



Europäisches Patentamt **European Patent Office** Office européen des brevets



① Veröffentlichungsnummer: 0 419 944 A2

(12)

EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

(1) Anmeldenummer: 90117567.9

2 Anmeldetag: 12.09.90

(1) Int. Cl.5: C07D 263/34, C07D 277/56, A01N 43/76, A01N 43/78

(3) Priorität: 26.09.89 DE 3932052

(3) Veröffentlichungstag der Anmeldung: 03.04.91 Patentblatt 91/14

 Benannte Vertragsstaaten: BE CH DE ES FR GB IT LI NL

71 Anmelder: BASF Aktiengesellschaft Carl-Bosch-Strasse 38 W-6700 Ludwigshafen(DE)

2 Erfinder: Ditrich, Klaus, Dr. Paray-le-Moniai-Strasse 12 W-6702 Bad Duerkheim(DE) Erfinder: Maywald, Volker, Dr. Berner Weg 24

W-6700 Ludwigshafen(DE)

Erfinder: Hamprecht, Gerhard, Dr.

Rote-Turm-Strasse 28 W-6940 Weinheim(DE)

Erfinder: Harreus, Albrecht, Dr.

Teichgasse 13

W-6700 Ludwigshafen(DE)

Erfinder: Wuerzer, Bruno, Dr.

Ruedigerstrasse 13 W-6701 Otterstadt(DE)

Erfinder: Westphalen, Karl-Otto, Dr.

Mausbergweg 58 W-6720 Speyer(DE)

Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide.

Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide der Formeln la und lb

Ib

in denen die Substituenten folgende Bedeutung haben:

X Sauerstoff oder Schwefel;

R¹ Wasserstoff; Halogen; gegebenenfalls substituiertes C1-C6-Alkyl, Benzyl, Cycloalkyl, Alkenyl, Alkinyl, Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio; Alkoxy; Alkylthio; Halogenalkoxy; Halogenalkylthio; oder einen gegebenenfalls substituierten 5- bis 6-gliedrigen heterocyclischen Rest;

R² Formyl, 4,5-Dihydrooxazol-2-yl oder den Rest -COYR⁵;

Y Sauerstoff oder Schwefel;

R⁵ Wasserstoff; Cycloalkyl; gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Phenyl, Benzyl, Alkenyl, Cycloalkenyl oder Alkinyl;

einen gegebenenfalls substituierten 5- oder 6-gliedrigen heterocyclischen Rest; Phthalimido; Tetrahydrophthalimido; Succinimido; Maleinimido;

ein Äquivalent eines Kations:

oder

einen Rest -N = CR6R7;

R⁶, R⁷ Wasserstoff; Alkyl; Cycloalkyl; Phenyl; Furyl oder zusammen eine Methylenkette mit 4 bis 7 Kettengliedem;

R³ Wasserstoff oder gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder Cycloalkyl;

R⁴ Hydroxy; Alkoxy;

gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Alkenyl, Alkinyl, Phenyl oder Naphthyl;

einen gegebenenfalls substituierten 5- bis 6-gliedrigen heterocyclischen Rest; oder R³ und R⁴ gemeinsam einen Rest der Struktur - $(CH_2)_n$ - Y_p - $(CH_2)_q$ -, wobei n und q 1, 2 oder 3, p 0 oder 1 und Y Sauerstoff, Schwefel oder N-Methyl bedeuten oder den Rest der Formel - $(CH_2)_3$ -CO- bilden, sowie deren umweltverträgliche Salze,

wobei in der Formel Ib X nicht Schwefel bedeutet, wenn R¹ 3-Pyridyl, R² CO₂CH₂CH₃ oder R³ Wasserstoff bedeutet, und wobei in der Formel la X nicht Schwefel oder R¹ nicht Thien-2-yl bedeutet, wenn YR⁵ für OH steht und R³ Wasserstoff und R⁴ Methyl bedeutet, Verfahren zur Herstellung und herbizide Mittel, die die Verbindungen der Formeln la oder Ib als Wirkstoffe enthalten.

OXAZOL- BZW. THIAZOLCARBONSÄUREAMIDE

Die vorliegende Erfindung betrifft Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide der Formeln la und Ib

5

in denen die Substituenten folgende Bedeutung haben:

X Sauerstoff oder Schwefel;

R¹ Wasserstoff; Halogen; C1-C6-Alkyl, welches ein bis fünf Halogenatome und/oder einen oder zwei der folgenden Reste tragen kann: C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-

15 C4-Halogenalkylthio oder Cyano;

Benzyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: C1-C4-Alkyl, C1-C4-Halogenalkyl, C1-C4-Alkoxy, C1-C4-Halogenalkoxy, C1-C4-Alkylthio, C1-C4-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro; C₃-C₈-Cycloalkyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: C₁-C₄-Alkyl oder Halogen;

C2-C6-Alkenyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen, C1-C3-Alkoxy und/oder ein 20 Phenyl, das seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C1-C4-Alkyl, C1-C4-Halogenalkyl, C1-C4-Alkoxy, C1-C4-Halogenalkoxy, C1-C4-Alkylthio, C1-C4-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro; C2-C5-Alkinyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen oder C1-C3-Alkoxy und/oder ein Phenyl, das seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C1-C4-Alkyl, C1-C4-Halogenalkyl, C1-C4-Alkoxy, C1-C4-Halogenalkoxy, C1-C4-Alkylthio, C1-C4-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano

oder Nitro:

 $C_1\text{-}C_4\text{-}Alkoxy; \ C_1\text{-}C_4\text{-}Alkylthio; \ C_1\text{-}C_4\text{-}Halogenalkoxy; \ C_1\text{-}C_4\text{-}Halogenalkylthio;}$

Phenoxy oder Phenylthio, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: C1-C4-Alkyl, C1-C4-Halogenalkyl, C1-C4-Alkoxy, C1-C4-Halogenalkoxy, C1-C4-Alkylthio, C1-C4-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro:

ein 5- bis 6-gliedriger heterocyclischer Rest, enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, wobei der Ring ein oder zwei der folgenden Reste tragen kann: C₁-C₃-Alkyl, Halogen, C₁-C₃-Alkoxy oder C₁-C₃-Alkoxycarbonyl;

Phenyl, welches eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C1-C6-Alkyl, C1-C6-Halogenalkyl, C1-C6-Alkoxy, C1-C6-Halogenalkoxy, C1-C6-Alkylthio, C1-C6-Halogenalkylthio, Halogen, Nitro und Cyano,

35 R² Formyl, 4,5-Dihydrooxazol-2-yl oder den Rest -COYR⁵;

Y Sauerstoff oder Schwefel;

R5 Wasserstoff:

C₁-C₆-Alkyl, welches ein bis fünf Halogenatome oder Hydroxygruppen und/oder einen der folgenden Reste tragen kann: C₁-C₄-Alkoxy, C₂-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy, Cyano, Trimethylsilyi, C₁-C₃-Alkylthio, C₁ lamino, C₁-C₃-Dialkylamino, C₃-C₇-Cycloalkylamino, C₁-C₃-Alkylsulfinyl, C₁-C₃-Alkylsulfonyl, Carboxyl, C₁-C₃-Alkoxycarbonyl, C₁-C₃-Dialkylaminocarbonyl, C₁-C₃-Dialkoxyphosphonyl, Alkaniminoxy, Thienyl, Furyl, Tetrahydrofuryl, Phthalimido, Pyridyl, Benzyloxy, Benzoyl, wobei die cyclischen Reste ihrerselts eine bis

drei der folgenden Gruppen tragen können: C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy oder Halogen; Benzyl, das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy, C₁-C₃-Halogenal-

kyl, Halogen, Nitro und Cyano;

C₃-C₈-Cycloalkyl;

Phenyl, das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C1-C4-Alkyl, C1-C4-Alkoxy, C1-C4-Halogenalkyl, C1-C4-Halogenalkoxy, C1-C4-Alkoxycarbonyl, Halogen, Nitro und Cyano;

C₃-C₈-Alkenyl, C₅-C₆-Cycloalkenyl oder C₃-C₈-Alkinyl, wobei diese Reste eine der folgenden Gruppen tragen können: Hydroxy, C₁-C₄-Alkoxy, Halogen oder einen Phenylring, welcher seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C1-C4-Alkyl, C1-C4-Alkoxy, C1-C4-Halogenalkyl, Halogen, Nitro und Cyano:

einen fünf- bis sechsgliedrigen heterocyclischen Rest enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff oder einen Benzotriazolrest;

Phthalimido; Tetrahydrophthalimido; Succinimido; Maleinimido;

ein Äquivalent eines Kations aus der Gruppe der Alkali- oder Erdalkalimetalle, Mangan, Kupfer, Eisen, Ammonium und substituiertes Ammonium;

einen Rest -N = CR6R7;

- 5 R⁶, R⁷ Wasserstoff; C₁-C₄-Alkyl; C₃-C₆-Cycloalkyl; Phenyl oder Furyl oder zusammen eine Methylenkette der Formel -(CH₂)_m- mit m = 4 bis 7 Kettengliedern;
 - R³ Wasserstoff; C₁-C₆-Alkyl, das einen bis drei der folgenden Substituenten tragen kann: Hydroxy, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio oder Di-C₁-C₃-Alkylamino;
- C₃-C₈-Cycloalkyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: C₁-C₄-Alkyl, Halogen und C₁-C₄0 Halogenalkyl;
 - R⁴ Hydroxy; C₁-C₄-Alkoxy;
 - C_1 - C_6 -Alkyl, das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Halogenalkylthio, C_1 - C_4 -Halogenalkylthio, C_1 - C_4 -Dialkylamino, Halogen, C_3 - C_8 -Cycloalkyl oder Phenyl, welches seinerseits ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen, Cyano, Nitro, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio;
- C₃-C₈-Cycloalkyi, das eine bis drei der folgenden Grupen tragen kann: C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Halogen, Nitro oder Cyano;
 - C₃-C₆-Alkenyl oder C₃-C₆-Alkinyl, das ein- bis dreimal durch Halogen und/oder einmal durch Phenyl substituiert sein kann, wobei der Phenylring seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann:
- 20 C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro;
 - ein 5- bis 6-gliedriger heterocyclischer Rest enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel oder Stickstoff, welcher ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: C₁-C₄-Alkyl oder Halogen;
- Phenyl, das eine bis vier der folgenden Gruppen tragen kann: C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Halogen, Nitro, Cyano, Formyl, C₁-C₄-Alkanoyl, C₁-C₄-Halogenalkanoyl oder C₁-C₄-Alkoxycarbonyl;

 Naphthyl, das ein- bis dreimal durch C₁-C₄-Alkyl oder Halogen substituiert sein kann,

oder

- R³ und R⁴ gemeinsam einen Rest der Struktur -(CH₂)n-Yp-(CH₂)q-, wobei n und q 1, 2 oder 3, p 0 oder 1 und Y Sauerstoff, Schwefel oder N-Methyl bedeuten oder den Rest der Formel -(CH₂)₃-CO- bilden, sowie deren umweltverträgliche Salze,
 - wobei in der Formel Ib X nicht Schwefel bedeutet, wenn R¹ 3-Pyridyl, R² CO₂CH₂CH₃ oder R³ Wasserstoff bedeutet und wobei in der Formel Ia X nicht Schwefel und R¹ nicht Thien-2-yl bedeutet, wenn YR⁵ für OH steht und R³ Wasserstoff und R⁴ Methyl bedeutet.

Weiterhin betrifft die Erfindung Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sowie herbizide Mittel, welche mindestens eine Verbindung la oder Ib enthalten, in denen die Substituenten die vorstehend gegebene Bedeutung haben und X Schwefel bedeuten kann, wenn R¹ 3-Pyridyl, R² CO₂CH₂CH₃ und R² Wasserstoff bedeutet, oder wenn R¹ Thien-2-yl, YR⁵ Hydroxy, R³ Wasserstoff und R⁴ Methyl bedeutet.

Oxazol- und Thiazolcarbonsäuren bzw. deren Derivate sind bekannt (DE-A 22 54 944, Bull. Soc. Chim. Fr., 1969, 2152 sowie DE-A 22 21 647). Mögliche Anwendungen dieser Substanzen als herbizide Mittel sind nicht beschrieben.

Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es, neue herbizid wirksame Verbindungen zu finden und zu synthetisieren.

Demgemäß wurden die eingangs definierten Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide la und lb gefunden.

Außerdem wurden Verfahren zu ihrer Herstellung gefunden und herbizide Mittel, welche Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide la und lb enthalten, in denen die Substituenten vorstehend gegebene Bedeutung haben.

Die erfindungsgemäßen Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide la und lb sind auf verschiedenen Wegen herstellbar. Man erhält sie beispielsweise nach den folgenden Verfahren:

1. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und lb, in denen R² CO₂R⁵ und R⁵ C₁-C₅-Alkyl bedeutet

55

45

$$R^{1} \times CO_{2}R^{5}$$

$$Ia \qquad Ib$$

$$(R^{5} = C_{1}-C_{6}-Alky1)$$

Man erhält diese Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide la und Ib dadurch, daß man einen Diester der Formei II in an sich bekannter Weise mit einem Äquivalent einer wäßrigen Base zum Monoester IIIa bzw. IIIb hydrolysiert und IIIa und IIIb danach getrennt oder im Gemisch zunächst in das Halogenid oder eine andere aktivierte Form der Carbonsäure überführt und diese Derivate anschließend mit einem Amin IV amidiert.

20
$$R_{1} \longrightarrow 0$$

$$R_{2} \longrightarrow 0$$

$$R_{3} \longrightarrow 0$$

$$R_{3} \longrightarrow 0$$

$$R_{4} \longrightarrow 0$$

$$R_{3} \longrightarrow 0$$

$$R_{4} \longrightarrow 0$$

$$R_{1} \longrightarrow 0$$

$$R_{3} \longrightarrow 0$$

$$R_{4} \longrightarrow 0$$

$$R_{1} \longrightarrow 0$$

$$R_{3} \longrightarrow 0$$

$$R_{4} \longrightarrow 0$$

$$R_{1} \longrightarrow 0$$

$$R_{1} \longrightarrow 0$$

$$R_{3} \longrightarrow 0$$

$$R_{4} \longrightarrow 0$$

$$R_{1} \longrightarrow 0$$

$$R_{1} \longrightarrow 0$$

$$R_{1} \longrightarrow 0$$

$$R_{2} \longrightarrow 0$$

$$R_{3} \longrightarrow 0$$

$$R_{4} \longrightarrow 0$$

$$R_{1} \longrightarrow 0$$

$$R_{3} \longrightarrow 0$$

$$R_{4} \longrightarrow 0$$

$$R_{1} \longrightarrow 0$$

$$R_{3} \longrightarrow 0$$

$$R_{4} \longrightarrow 0$$

$$R_{1} \longrightarrow 0$$

$$R_{1} \longrightarrow 0$$

$$R_{2} \longrightarrow 0$$

$$R_{3} \longrightarrow 0$$

$$R_{4} \longrightarrow 0$$

$$R_{1} \longrightarrow 0$$

$$R_{3} \longrightarrow 0$$

$$R_{4} \longrightarrow 0$$

$$R_{1} \longrightarrow 0$$

$$R_{2} \longrightarrow 0$$

$$R_{3} \longrightarrow 0$$

$$R_{4} \longrightarrow 0$$

$$R_{5} \longrightarrow 0$$

$$R_{5} \longrightarrow 0$$

$$R_{1} \longrightarrow 0$$

$$R_{4} \longrightarrow 0$$

$$R_{5} \longrightarrow 0$$

$$R_{5} \longrightarrow 0$$

$$R_{1} \longrightarrow 0$$

$$R_{1} \longrightarrow 0$$

$$R_{2} \longrightarrow 0$$

$$R_{3} \longrightarrow 0$$

$$R_{4} \longrightarrow 0$$

$$R_{4} \longrightarrow 0$$

$$R_{5} \longrightarrow 0$$

$$R_{1} \longrightarrow 0$$

$$R_{1} \longrightarrow 0$$

$$R_{2} \longrightarrow 0$$

$$R_{3} \longrightarrow 0$$

$$R_{4} \longrightarrow 0$$

$$R_{4} \longrightarrow 0$$

$$R_{5} \longrightarrow 0$$

$$R_{1} \longrightarrow 0$$

$$R_{1} \longrightarrow 0$$

$$R_{2} \longrightarrow 0$$

$$R_{3} \longrightarrow 0$$

$$R_{4} \longrightarrow 0$$

$$R_{4} \longrightarrow 0$$

$$R_{5} \longrightarrow 0$$

$$R$$

Die einzelnen Reaktionsschritte A und B dieser Synthesesequenz können wie folgt durchgeführt werden:

Reaktionsschritt A:

5

10

15

35

Die partielle Verseifung des Diesters II zum Monoester Va und Vb wird üblicherweise bei Temperaturen von -20 bis 60°C, vorzugsweise -10 bis 30°C, in einem inerten, mit Wasser mischbaren organischen Lösungsmittel in Gegenwart von 1,0 bis 1,2 mol-äq. einer Base durchgeführt.

Als Basen eignen sich insbesondere Hydroxyde von Alkalimetall-Kationen. Die Base wird im allgemeinen als 5 bis 20 %ige wäßrige Lösung zugesetzt.

Bevorzugte Lösungsmittel für diese Umsetzung sind beispielsweise Dioxan oder der der Esterkomponente in der Formel II entsprechende Alkohol.

Zur Aufarbeitung wird das Reaktionsgemisch üblicherweise angesäuert, wobei sich das gewünschte Produkt als Feststoff oder als ÖI abscheidet. Die Isolierung erfolgt in üblicher Weise durch Filtration bzw. Extraktion.

Das Gemisch der beiden isomeren Monoester IIIa und IIIb kann durch fraktionierte Kristallisation oder auf chromatographischem Wege getrennt werden oder es kann ohne Trennung weiter umgesetzt werden.

Reaktionsschritt B:

Man erhält die Verbindungen la bzw. Ib aus den Monoestern Illa und Illb, in dem man Illa und Illb zunächst in an sich bekannter Weise in das Halogenid oder eine andere aktivierte Form der Carbonsäurefunktion überführt und diese Derivate anschließend mit einem Amin IV amidiert.

Aktivierte Formen der Carbonsäure sind neben Halogeniden wie insbesondere den Chloriden und den

Bromiden beispielsweise auch Imidazolide. Im allgemeinen werden die Halogenide bevorzugt.

5

15

25

30

35

50

Man erhält sie durch Umsetzung der Carbonsäuren Illa und Illb mit einem Halogenierungsmittel wie Thionylchlorid, Thionylbromid, Phosphoroxychlorid bzw. -bromid, Phosphortri- und -pentachlorid bzw. -bromid, Phosgen sowie elementarem Chlor und Brom.

Das Halogenierungsmittel wird in 1 bis 5 mol-äq., vorzugsweise 1 bis 2 mol.äq., eingesetzt.

Die Umsetzung verläuft bei Temperaturen von 0°C bis zum Siedepunkt des Halogenierungsmittels bzw. sofern man in Gegenwart eines inerten organischen Lösungsmittels arbeitet, auch dessen Siedepunkt, vorzugsweise 20 bis 120°C.

Als Lösungsmittel eignen sich beispielsweise Kohlenwasserstoffe und Halogenkohlenwasserstoffe wie Tetrachlorethan, Methylenchlorid, Chloroform, Dichlorethan, Chlorbenzol, 1,2-Dichlorbenzol, Benzol, Toluol und Xylol.

Üblicherweise werden die aktivierten Carbonsäurederivate isoliert, beispielsweise durch abdestillieren des Halogenierungsmittels und sofern vorhanden des Lösungsmittels und erst anschließend mit den Aminen IV umgesetzt.

In diesem Fall wird die Amidierung bei Temperaturen von -20 bis 100°C, vorzugsweise -10 bis 20°C in einem inerten aprotisch polaren organischen Lösungsmittel durchgeführt.

Für diese Umsetzung eignen sich insbesondere Halogenkohlenwasserstoffe wie Dichlormethan und Ether wie Diethylether und tert.-Butylmethylether als Lösungsmittel.

Da bei der Amidierung von Säurehalogeniden Halogenwasserstoff gebildet wird, empfiehlt es sich, das Amin IV in 2 bis 5 mol.-äq. Überschuß, vorzugsweise 2 bis 3 mol.-äq. zuzusetzen. Sofern das Amin in äquimolaren Mengen (1 bis 1,2 mol-äq.) eingesetzt wird, sollte zum Binden des Halogenwasserstoffs eine Base, insbesondere ein tertiäres Amin wie Triethylamin oder Pyridin zugegeben werden.

Sofern man von einem Gemisch der Monoester Illa und Illb ausgeht erhält man bei der Umsetzung ein Gemisch aus den Isomeren Carbonsäureamiden la und Ib. Dieses Gemisch kann auf herkömmliche Weise, beispielsweise durch fraktionierte Kristallisation oder Chromatographie in die Einzelkomponenten aufgetrennt werden.

Die für diese Synthesesequenz benötigten Edukte II sind bekannt (Bull. Soc. Chim. Fr. 1974, 2079) oder nach bekannten Methoden (Bull. Soc. Chim. Fr. 1969, 1762; J. Chem. Soc., 1953, 93) zugänglich.

2. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und lb, in denen X Schwefel und R² CO₂H bedeutet

Man erhält diese Thiazolcarbonsäureamide la und lb besonders vorteilhaft, indem man ein Dicarbonsäureanhydrid der Formel V in an sich bekannter Weise mit einem Amin der Formel IV zu den Isomeren la und lb umsetzt und anschließend das Gemisch in die Isomeren auftrennt.

Die Umsetzung wird üblicherweise bei Temperaturen von -10 bis 150°C, vorzugsweise 20 bis 120°C in einem inerten aprotisch polaren organischen Lösungsmittel durchgeführt.

Insbesondere kommen als Lösungsmittel Halogenkohlenwasserstoffe, z.B. Tetrachlorethan, Methylen-chlorid, Chloroform, Dichlorethan, Chlorbenzol und 1,2-Dichlorbenzol; Ether z.B. Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Dimethoxyethan, Diethylenglykoldimethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan; dipolare aprotische Lösungsmittel, z.B. Acetonitril, Dimethylformamid, Dimethylacetamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, 1,3-Dimethyltetrahydro-2(1H)-pyrimidinon und 1,3-Dimethylimidazolidin-2-on; Aromate, z.B. Benzol, Toluol, Xylol, Pyridin und Chinolin; Ketone, z.B. Aceton, Methylethylketon oder entsprechende Gemische zur

Anwendung.

Das Amin IV wird im allgemeinen in äugimolaren Mengen oder im Überschuß, vorzugsweise in Mengen von 1,0 bis 5,0 mol-äq. bezogen auf V eingesetzt.

Die für dieses Verfahren benötigten Dicarbonsäureanhydride sind bekannt oder können nach bekannten Methoden hergestellt werden (Bull. Soc. Chim. Fr. 1969, 1762; CS-A-195 369; CS-A-195 370).

3. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und Ib in denen R¹ nicht Halogen und R² Carboxyl oder Formyl bedeutet

10

$$R^{1}$$
 R^{2}
 R^{2}
 R^{2}
 R^{3}
 R^{1}
 R^{2}
 R^{3}
 R^{2}
 R^{3}
 R^{2}
 R^{3}
 R^{2}
 R^{3}
 R^{2}
 R^{3}
 R^{2}
 R^{3}
 R^{3}
 R^{2}
 R^{3}
 R^{3}

Man erhält diese isomeren Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide, indem man eine Carbonsäure IIIc bzw. IIId gemäß den unter 1 B geschilderten Bedingungen aktiviert und amidiert und die so erhaltenen Amide Vla und Vlb anschließend in an sich bekannter Weise in Gegenwart eines Carboxylierungs-oder Formylierungsreagens' umsetzt.

Der Reaktionsschritt A. dieser Synthesesequenz wird im allgemeinen und im besonderen entsprechend den im Verfahren 1 unter Punkt B beschriebenen Bedingungen durchgeführt.

Reaktionsschritt B.

40

Die Carboxylierung bzw. Formylierung der Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide VIa bzw. VIb erfolgt in der Regel bei Temperaturen von 0 bis -100°C, vorzugsweise -50 bis -80°C in einem aprotisch polaren inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base unter Ausschluß von Feuchtigkeit.

Bevorzugtes Carboxylierungsreagens ist gasförmiges oder festes Kohlendioxid, als Formylierungsreagens dient insbesondere Dimethylformamid und N-Formylmorpholin.

Geeignete Lösungsmittel sind insbesondere Ether, z.B. Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Dimethoxyethan, Diethylenglykoldimethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan.

Als Basen finden bevorzugt Organometallverbindungen Methyllithium, n-Butyllithium, s-Butyllithium, t-Butyllithium oder Phenyllithium Verwendung.

Die Umsetzung wird üblicherweise so durchgeführt, daß zunächst eine Lösung des Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamids VIa bzw. VIb mit bis 3 mol-äq der gelösten Base versetzt wird, wobei ein am Heterocyclus metalliertes Derivat entsteht, welches bei der anschließenden Zugabe des elektrophilen Carboxylierungs- bzw. Formylierungsreagens' zum gewünschten Produkt la bzw. Ib abreagiert.

Sofern R³ Wasserstoff bedeutet werden entsprechend mehr mol-äq. der Base benötigt, da in diesem Fall zunächst der Amid-Stickstoff deprotoniert wird. Vorzugsweise verwendet man daher bei der Umetzung von Carbonsäureamiden VIa bzw. VIb, in denen R³ Wasserstoff bedeutet 2 bis 2,5 mol-äq der Base.

Verbindungen VIa bzw. VIb, in denen R¹ Wasserstoff bedeutet werden bei der Umsetzung mit der Base zunächst in 2-Position des Heterocyclus' metalliert.

Um in diesem Fall den Carboxyl- bzw. Formylrest in Nachbarstellung zur Amidgruppe einzuführen ist es notwendig, von Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamiden VIa bis VIb auszugehen, in denen R³ Wasserstoff bedeutet.

Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide la bzw. Ib in denen R¹ Wasserstoff und R³ nicht Wasserstoff bedeutet erhält man aus den nach dem vorstehenden Verfahren zugänglichen Verbindungen, in denen R¹ und R³ Wasserstoff bedeutet, in an sich bekannter Weise durch nachträgliche Alkylierung oder Cycloalkylierung.

Die für das vorstehende Verfahren benötigten Carbonsäuren IIIc und IIId sind literaturbekannt Beilstein, (Band 27, 1.-5. Erg.Werte) oder sie können nach bekannten Methoden, beispielsweise durch Oxidation der entsprechenden Alkohole oder Aldehyde oder durch Hydrolyse der entsprechenden Nitrile hergestellt werden (J.V. Metzger in "The Chemistry of Heterocyclic Compounds, Vol. 34, Part 1, Thiazol and its Derivatives", Arnold Weissberger and E.D. Ward C. Taylor (Editors), John Wiley and Sons, S. 519 ff, I.J. Turchi in "The Chemistry of Heterocyclic Compounds, Vol. 45, Oxazoles", Arnold Weissberger and E.D. Ward, C. Taylor (Editors), John Wiley and Sons).

4. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und lb, in denen R2 Carboxyl bedeutet.

Man erhält diese Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide la und lb beispielsweise dadurch, daß man ein entsprechendes Carbonsäureamid la bzw. lb, in dem R² für CO₂R⁵ und R⁵ für C₁-C₅-Alkyl steht in an sich bekannter Weise mit einem Äquivalent einer wäßrigen Base hydrolysiert. Die Umsetzung ist im folgenden Schema lediglich für die Carbonsäureamide la gezeigt. Sofern man von den entsprechenden Carbonsäureamiden lb ausgeht verläuft sie analog.

Diese Synthese wird im allgemeinen und im besonderen entsprechend den im Verfahren 1 unter Punkt A beschriebenen Bedingungen durchgeführt.

5. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und lb, in denen R2 COYR5 bedeutet:

Man erhält diese Carbonsäureamide la und lb, in dem man eine entsprechende Carbonsäure la bzw. lb $(R^2 = CO_2H)$ aktiviert und anschließend in an sich bekannter Weise mit einer Verbindung VII umsetzt.

55

10

20

25

35

45

50

Die Umsetzung kann bei Temperaturen von -20°C bis zur Rückflußtemperatur des Lösungsmittels bzw. -gemisches, vorzugsweise bei 0 bis 60°C durchgeführt werden.

Zweckmäßigerweise verwendet man für diese Umsetzungen Lösungsmittel wie Halogenkohlenwasserstoffe, z.B. Tetrachlorethan, Methylenchlorid, Chloroform, Dichlorethan, Chlorbenzol und 1,2-Dichlorbenzol; Ether z.B. Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Dimethoxiethan, Diethylenglykoldimethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan; Aromaten z.B. Benzol, Toluol oder Xylol; oder entsprechende Gemische.

Als wasserentziehende Mittel kommen Dicyclohexylcarbodiimid oder Propanphosphonsäureanhydrid in Betracht.

20

25

35

40

45

50

55

Die molaren Verhältnisse, in denen die benötigten Ausgangsverbindungen miteinander umgesetzt werden, betragen im allgemeinen 0,5:1 bis 2:1 für das Verhältnis von Carbonsäure IVa zu Alkohol oder Thiol und 1:1 bis 1:3 für das Verhältnis von Carbonsäure IVa zu wasserentziehendem Mittel.

Die Konzentration der Edukte im Lösungsmittel beträgt im allgemeinen 0,1 bis 5 mol/l, bevorzugt 0,2 bis 2 mol/l.

Besonders bevorzugt arbeitet man in Ethern wie Diethylether, Tetrahydrofuran oder Dioxan; mit Propanphosphonsäureanhydrid als wasserentziehendem Mittel bei 20 bis 60°C.

6. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und lb, in der R² eine 4,5-Dihydro-oxazol-2-yl-gruppe bedeutet

Man erhält diese Verbindungen dadurch, daß man ein entsprechendes Carbonsäurederivat la bzw. lb, in dem R^2 eine Gruppe $CO_2R^{'}$ oder COOH und $R^{'}$ C_1 - C_4 -Alkyl bedeutet, in an sich bekannter Weise mit einem Aminoalkohol der Formel VIII umsetzt.

9

5 R1 X CO₂H Oder R1 X R4 + H₂N Olympia Signature
$$R^{1}$$
 R^{3} R^{4} R^{4} R^{4} R^{4} R^{3} R^{4} R^{4}

Die Reaktion wird so durchgeführt, daß man die Verbindungen bei 0 bis 180°C, vorzugsweise bei Rückflußtemperatur des verwendeten Gemisches mit einem Aminoalkohol VIII, gegebenenfalls in Gegenwart eines inerten Lösungsmittels umsetzt. Ester oder Carbonsäure la bzw. Ib und Aminoalkohol VIII werden dabei im Verhältnis 1:1 bis 1:2,5, vorzugsweise 1:1 bis 1:1,5 eingesetzt.

Als Lösungsmittel verwendet man zweckmäßigerweise Halogenkohlenwasserstoffe wie Chlorbenzol und 1,2-Dichlorbenzol, Ether, z.B. Methyl-tert.-butylether, 1,2-Dimethoxyethan, Diethylenglykol-dimethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan; Alkohole wie Methanol, Ethanol, Propanol oder Ethylenglykol, dipolare aprotische Lösungsmittel, z.B. Acetonitril, Dimethylformamid, Dimethylacetamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, 1,3-Dimethyltetrahydro-2(1H)-pyrimidinon und 1,3-Dimethylimidazolin-2-on oder Aromaten, z.B. Benzol, Toluol und Xylol. Die Konzentration der Edukte im Lösungsmittel beträgt im allgemeinen 0,1 bis 5,0 mol/l, bevorzugt 0,2 bis 2,0 mol/l.

Die Umsetzung ist im allgemeinen nach 14 Stunden beendet; die Carbonsäureamide la und Ib werden dann gegebenenfalls durch Zugabe von Wasser ausgefällt, abgesaugt oder mit einem organischen Lösungsmittel extrahiert und mit üblichen Standardmethoden wie Umkristallisation oder Chromatographie gereinigt.

30

35

40

45

55

Man erhält die Verbindungen der Formel VIa, in denen R¹ einen Alkohol oder Thiolrest -ZR⁸ bedeutet, in an sich bekannter Weise (Helv. Chim. Acta, 37, 2059 (1954)) durch Umsetzung eines 2-Halogen-thiazol-4-carbonsäureamids VIa (DE 22 41 035) in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base mit einem Alkohol oder Thiol.

Hal in Formel VIa bedeutet dabei ein Halogenatom wie Fluor, Chlor, Brom und lod; insbesondere eignen sich Verbindungen VIa, in denen Hal, Chlor oder Brom bedeutet.

R¹ in Formel Vla bedeutet C¹-C₄-Alkoxy, C¹-C₄-Alkylthio, die bis zu dreimal mit Halogen substituiert sein können, insbesondere Methoxy, Ethoxy, ¹-Methyl-ethoxy, ¹,¹-Dimethylethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluormethylthio; oder Phenoxy oder Phenylthio, die bis zu dreimal durch C¹-C₄-Alkyl, C¹-C₄-Halogenalkyl, C¹-C₄-Alkylthio, C¹-C₄-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro substituiert sein können, insbesondere ²,²-Dichlorphenoxy, ²,²-Difluorphenoxy, ²,²-Trifluorphenoxy, p-Trifluormethylphenoxy, ²-Chlor-4-Trifluorphenoxy, ³-Cyanophenoxy, 4-Cyano-2-methoxyphenoxy, 4-Nitrophenoxy, ²-Fluorthiophenyl, 4-Trifluormethylthiophenyl, ³-Cyanothiophenyl.

Zweckmäßigerweise verwendet man für diese Umsetzungen Lösungsmittel wie Halogenkohlenwasserstoffe, z.B. Tetrachlorethan, Methylenchlorid, Chloroform, Dichlorethan, Chlorbenzol und 1,2-Dichlorbenzol; Ether, z.B. Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Dimethoxiethan, Diethylenglykoldimethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan; dipolare aprotische Lösungsmittel, z.B. Acetonitril, Dimethylformamid, Dimethylacetamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, 1,3-Dimethyltetrahydro-2(1H)-pyrimidinon und 1,3-

Dimethylimidazolidin-2-on; Aromaten, z.B. Benzol, Toluol, Xylol, Pyridin und Chinolin; Ketone, z.B. Aceton, Methylethylketon; Alkohole, z.B. Methanol, Ethanol, iso-Propanol und tert.-Butanol oder entsprechende Gemische.

Die Umsetzung kann bei Temperaturen von -100°C bis zur Rückflußtemperatur des jeweiligen Lösungsmittels bzw. -gemisches, vorzugsweise bei -60°C bis 150°C, durchgeführt werden.

Als Basen dienen Hydride und Alkoxide von Alkali- und Erdalkalimetallkationen, insbesondere NaH, KH, CaH₂, LiH und KO-t.-Bu. Mitunter ist es auch nützlich Kombinationen der oben angeführten Basen zu verwenden.

Die molaren Verhältnisse, in denen die benötigten Ausgangsverbindungen miteinander umgesetzt werden, betragen im allgemeinen 3:1 bis 1:1 für das Verhältnis von Alkohol oder Thiol zu 2-Halogen-thiazol-4-carbonsäureamid Vla und 1:1 bis 1:3 für das Verhältnis von Alkohol oder Thiol zur wirksamen Base.

Die Konzentration der Edukte im Lösungsmittel berägt im allgemeinen 0,1 bis 5 mol/l, bevorzugt 0,2 bis 2 mol/l.

Besonders bevorzugt arbeitet man in aprotisch dipolaren Solventien wie Acetonitril, Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, 1,3-Dimethyltetrahydro-2(1H)-pyrimidinon, 1,3-Dimethylimidazolidin-2-on oder Ethern wie 1,2-Dimethoxiethan, Diethylenglykoldimethylether, Tetrahydrofuran oder Dioxan bei Temperaturen zwischen 50°C und 150°C unter Verwendung von NaH oder KO-t.-Ba als Basen.

Die für die Umsetzung benötigten 2-Halogen-thiazol-4-carbonsäureamide der Formel IIIa können nach literaturbekannten Methoden aus den entsprechenden Carbonsäurehalogeniden durch Umsetzung mit Aminen gewonnen werden (DE-A 22 41 035).

Die zum Einsatz kommenden Alkohole oder Thiole sind in vielen Fällen kommerziell erhältlich oder können in an sich bekannter Weise hergestellt werden.

Des weiteren erhält man die Verbindungen der Formel VIb in an sich bekannter Weise (Helv. Chim. Acta, 37, 2059 (1954)) durch Umsetzung eines 2-Halogen-thiazol-5-carbonsäureamids IIIb in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base mit einem Alkohol oder Thiol gemäß Schema 2:

30

Hal in Formel VIb bedeutet dabei ein Halogenatom wie Fluor, Chlor, Brom und lod; insbesondere eignen sich Verbindungen VIb, in denen Hal, Chlor oder Brom bedeutet.

R¹ in Formel VIb bedeutet C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, die bis zu dreimal mit Halogen substituiert sein können:

insbesondere Methoxy, Ethoxy, 1-Methyl-ethoxy, 1,1-Dimethylethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluormethylthio; oder Phenoxy oder Phenylthio, die bis zu dreimal durch C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro substituiert sein können; insbesondere 2,4-Dichlorphenoxy, 2,4-Difluorphenoxy, 2,4-6-Trifluorphenoxy, p-Trifluormethylphenoxy, 2-Chlor-4-Trifluorphenoxy, 3-Cyanophenoxy, 4-Cyano-2-methoxyphenoxy, 4-Nitrophenoxy, 2-Fluorthiophenyl, 4-Trifluormethylthiophenyl, 3-Cyanothiophenyl.

Zweckmäßigerweise verwendet man für diese Umsetzungen Lösungsmittel wie Halogenkohlenwasserstoffe, z.B. Tetrachlorethan, Methylenchlorid, Chloroform, Dichlorethan, Chlorobenzol und 1,2-Dichlorbenzol; Ether, z.B. Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Dimethoxiethan, Diethylenglykoldimethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan; dipolare aprotische Lösungsmittel, z.B. Acetonitril, Dimethylformamid, Dimethylacetamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, 1,3-Dimethyltetrahydro-2(1H)-pyrimidinon und 1,3-Dimethylimidazolidin-2-on; Aromaten, z.B. Benzol, Toluol, Xylol, Pyridin und Chinolin; Ketone, z.B. Aceton, Methylethylketon; Alkohole, z.B. Methanol, Ethanol, iso-Propanol und tert.-Butanol oder entsprechende Gemische.

Die Umsetzung kann bei Temperaturen von -100°C bis zur Rückflußtemperatur des jeweiligen Lösungsmittels bzw. -gemisches, vorzugsweise bei -60°C bis 150°C, durchgeführt werden.

Als Basen dienen Hydride und Alkoxide von Alkali- und Erdalkalimetallkationen, insbesondere NaH, KH, CaH₂, LiH und KO-t.-Bu. Mitunter ist es auch nützlich Kombinationen der oben angeführten Basen zu verwenden.

Die molaren Verhältnisse, in denen die benötigten Ausgangsverbindungen miteinander umgesetzt werden, betragen im allgemeinen 3:1 bis 1:1 für das Verhältnis von Alkohol oder Thiol zu 2-Halogen-thiazol-

4-carbonsäureamid VIb und 1:1 bis 1:3 für das Verhältnis von Alkohol oder Thiol zur wirksamen Base.

Die Konzentration der Edukte im Lösungsmittel berägt im allgemeinen 0,1 bis 5 mol/l, bevorzugt 0,2 bis 2 mol/l.

Besonders bevorzugt arbeitet man in aprotisch dipolaren Solventien wie Acetonitril, Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, 1,3- Dimethyltetrahydro-2(1H)-pyrimidinon, 1,3-Dimethylimidazolidin-2-on oder Ethern wie 1,2-Dimethoxiethan, Diethylenglykoldimethylether, Tetrahydrofuran oder Dioxan bei Temperaturen zwischen 50°C und 150°C unter Verwendung von NaH oder KO-t.-Butylat als Basen.

Die für die Umsetzung benötigten 2-Halogen-thiazol-4-carbonsäureamide der Formel VIb können nach literaturbekannten Methoden aus den entsprechenden Carbonsäurehalogeniden durch Umsetzung mit Aminen gewonnen werden (US-A-4 001 421).

Verbindungen der Formel IVb können gewonnen werden, indem man Dicarbonsäureester der Formel XI in an sich bekannter Weise mit Aminen umsetzt und die resultierenden Amide IXb gemäß Schema G verseift:

Zweckmäßigerweise geht man dabei so vor, daß man den Diester II in einem inerten organischen Lösungsmittel löst und mit einem Amin umsetzt.

Als Lösungsmittel verwendet man für diese Umsetzungen Ether, z.B. Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Dimethoxyethan, Diethylenglykoldimethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan; Aromaten, z.B. Benzol, Toluol, Xylol oder Mesitylen; Alkohole, z.B. Methanol, Ethanol, iso-Propanol und tert.-Butanol oder entsprechende Gemische.

Die Umsetzung kann bei Temperaturen von -100°C bis zur Rückflußtemperatur des jeweiligen Lösungsmittels bzw. -gemisches, vorzugsweise bei -60°C bis 150°C, durchgeführt werden.

Das molare Verhältnis, in dem Diester II und Amin eingesetzt werden, beträgt 1:1 bis 1:2, vorzugsweise 1:1 bis 1:1,2.

Die Konzentration der Edukte im Lösungsmittel beträgt im allgemeinen 0,1 bis 5 mol/l, bevorzugt 0,2 bis 2,0 mol/l.

Besonders bevorzugt arbeitet man in Alkoholen wie Ethanol in Gegenwart von einem Äquivalent Amin bei 50 bis 100°C. Die für die Umsetzung benötigten Diester XI, sind literaturbekannt oder können in Anlehnung an beschriebene Methoden hergestellt werden (Bull. Soc. Chim. Fr., 1969, 1762; J. Chem. Soc., 1953, 93).

Neben den vorstehend geschilderten Verfahren 1-7 zur Herstellung der Verbindungen la, ib und ic gibt es weitere Synthesemöglichkeiten, die den folgenden Literaturstellen zu entnehmen sind:

Beilstein, Hauptwerk sowie 1.-5. Erg.Werk, Band 27; R.W. Wiley, The Chemistry of Heterocyclic Compounds, Five- and Six-Membered Compounds with Nitrogen and Oxygen, Interscience Pubishers, New York, London (1962), Heterocyclic Chemistry, Vol. 6, Five-membered Rings with Two or More Oxygen, Sulfur or Nitrogen Atoms, Pergamon Press, 1984, J. March, Advanced Organic Chemistry, Third Adition, John Wiley and Sons, 1985, Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie, 4. Auflage, Thieme Verlag, Bände IV, VI, VII, VIII, X.

Im Hinblick auf die bestimmungsgemäße Verwendung der Verbindungen la und Ib kommen als Substituenten bevorzugt folgende Reste in Betracht:

X Sauerstoff oder Schwefel

R1 Wasserstoff;

30

40

Halogen wie Fluor, Chlor, Brom und lod, insbesondere Fluor und Chlor;

C₁-C₆-Alkyl, wie Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sek.-Butyl, iso-Butyl und tert.-Butyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl, insbesondere Methyl, Ethyl, Propyl und iso-Propyl, welches ein bis fünf Halogenatome, insbesondere Fluor-

und/ oder Chloratome oder einen oder zwei der folgenden Reste tragen kann: Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl, insbesondere Cyclopropyl; Alkoxy wie Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, 2-Methylethoxy, n-Butoxy, 1-Methylpropoxy, 2-Methylpropoxy und 1,1-Dimethylethoxy, insbesondere Methoxy, Ethoxy, 1-Methylethoxy und 1,1-Dimethylethoxy; Halogenalkoxy wie Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Dichlorfluormethoxy, 1-Fluorethoxy, 2-Fluorethoxy, 2,2-Difluorethoxy, 1,1,2,2-Tetrafluorethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-1,1,2-trifluorethoxy und Pentafluorethoxy, insbesondere Trifluormethoxy und Pentafluorethoxy; Alkylthio wie Methylthio, Ethylthio, Propylthio, 1-Methylethylthio, Butylthio, 1-Methylpropylthio, 2-Methylpropylthio und 1,1-Dimethylethylthio, insbesondere Methylthio und Ethylthio; Halogenalkylthio wie Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Chlordifluormethylthio, 1-Fluorethylthio, 2-Fluorethylthio, 2,2-Difluorethylthio, 2,2,2-Trifluorethylthio, 2-Chlor-2,2-difluorethylthio, 2,2-Dichlor-2-fluorethylthio, 2,2,2-Trichlorethylthio und Pentafluorethylthio, insbesondere Difluormethylthio und Pentafluorethylthio oder Cyano:

Benzyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und iso-Propyl; Halogenalkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethyl und Chlordifluormethyl; Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethoxy, Pentafluorethoxy und Trichlormethoxy; Alkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio; Halogenalkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Difluormethylthio, Pentafluorethylthio und Trifluormethylthio; Halogen wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor und Chlor; Cyano oder Nitro;

Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclohexyl und Cyclooctyl, insbesondere Cyclopropyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Methyl oder Halogen wie vorstehend genannt, insbesondere Chlor und Fluor:

Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,1-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyi, 4-Hexenyi, 5-Hexenyi, 1-Methyl-1-pentenyi, 2-Methyl-1-pentenyi, 3-Methyl-1-pentenyi, 4-Methyl-1-pentenyi, 1-Methyl-2-pentenyi, 2-Methyl-2-pentenyi, 3-Methyl-2-pentenyi, 4-Methyl-2-pentenyi, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Mehyl-3-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl tenyi, 4-Methyl-3-pentenyi, 1-Methyl-4-pentenyi, 2-Methyl-4-pentenyi, 3-Methyl-4-pentenyi, 4-Methyl-4-pentenyi tenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl, 1,3-Dimet Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3butenyl, 2,3-Dimethyl-1-butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dimethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1-propenyl und 1-Ethyl-2methyl-2-propenyl, insbesondere Allyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen wie oben genannt, insbesondere Fluor und Chlor; Alkoxy wie obengenannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy, und/oder ein Phenyl, das seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und iso-Propyl; Halogenalkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethyl und Chlordifluormethyl; Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethoxy, Pentafluorethoxy und Trichlormethoxy; Alkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio; Halogenalkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Difluormethylthio, Pentafluorethylthio und Trifluormethylthio; Halogen wie

vorstehend genannt, insbesondere Fluor und Chlor, Cyano oder Nitro;
Alkinyl wie Ethinyl, 1-Propinyl, Propargyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Alkinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-4-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl, insbesondere Propargyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen wie oben genannt, insbesondere lod; Alkoxy wie oben genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy, und/oder ein Phenyl, das seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und iso-Propyl; Halogenalkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethyl und Chlordifluormethyl; Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Methoxy wie Vorstehend genannt, insbes

dere Trifluormethoxy, Pentafluorethoxy und Trichlormethoxy; Alkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio; Halogenalkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Difluormethylthio, Pentafluorethylthio und Trifluormethylthio; Halogen wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor und Chlor, Cyano oder Nitro;

- 5 C₁-C₄-Alkoxy wie obenstehend genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy;
 - C₁-C₄-Halogenalkoxy wie obenstehend genannt, insbesondere Trifluormethoxy, Pentafluorethoxy und Trichlormethoxy;
 - C1-C4-Alkylthio wie obenstehend genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio;
- C₁-C₄-Halogenalkylthio wie obenstehend genannt, insbesondere Difluormethylthio, Pentafluorethylthio und o Trifluormethylthio;
 - Phenoxy oder Phenylthio, wobei diese Reste ein bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und iso-Propyl; Halogenalkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethyl und Chlordifluormethyl; Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethoxy, Pentafluorethoxy und Trichlormethoxy; Alkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio; Halogenalkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Difluormethylthio, Pentafluorethylthio und Trifluormethylthio; Halogen wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor und Chlor, Cyano oder Nitro;
- ein 5- bis 6-gliedriger heterocyclischer Rest enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff wie 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 4-Tetrahydropyranyl, 2-Tetrahydropyranyl, 3-Tetrahydropyranyl, 3-Tetrahydropyranyl, 3-Tetrahydropyranyl, 3-Tetrahydropyranyl, 3-Tetrahydropyranyl, 3-Isoxazolyl, 4-Isoxazolyl, 5-Isothiazolyl, 4-Isothiazolyl, 3-Isothiazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Thiazolyl, 4-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 5-Oxazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 5-Imidazolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Pyrrazolyl, 4-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 4-Pyridyl, 3-Pyridyl und 2-Pyridyl, wobei dieser Ring ein oder zwei der folgenden Reste tragen kann: Alkyl wie oben genannt, insbesondere Methyl;
- Halogen wie oben genannt, insbesondere Fluor und Chlor; Alkoxy wie oben genannt, insbesondere Methoxy und Etoxy oder Alkoxycarbonyl wie Methoxycarbonyl und Etoxycarbonyl, insbesondere Methoxycarbonyl; Phenyl, welches eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Alkyl wie bei R¹ genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und iso-Propyl; Halogenalkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethyl und Chlordifluormethyl; Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Meth oxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethoxy, Pentafluorethoxy und Trichlormethoxy; Alkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio; Halogenalkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Difluormethylthio, Pentafluorethylthio und Trifluormethylthio; Halogen wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor und Chlor, Cyano oder Nitro;

R² Formyl, 4,5-Dihydroxazol-2-yl oder den Rest -COYR⁵

35 und

Y Sauerstoff oder Schwefel:

R5 Wasserstoff;

Alkyl, wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl und n-Hexyl, weiches ein bis fünf Halogenatome wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor oder Hydroxygruppen und/oder einen der folgenden Reste tragen kann: Alkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Alkoxy-alkoxy wie Methoxy-ethoxy, Ethoxy-ethoxy, Propoxy-ethoxy, insbesondere Methoxy-ethoxy; Cyano; Trimethylsilyl: Alkylthio wie unter R1 genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio; Alkylamino wie Methylamino, Ethylamino, Propylamino, iso-Propylamino, insbesondere Methylamino und Ethylamino; Dialkylamino wie Dimethylamino, Diethylamino, Dipropylamino, Diisopropylamino, Methylethylamino, insbesondere Dimethylamino und Methylethylamino; Cycloalkylamino wie Cyclopropylamino, Cyclobutylamino, Cyciopentylamino, Cyclohexylamino und Cycloheptylamino, insbesondere Cyclopropylamino; Alkylsulfinyl wie Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Propylsulfinyl, iso-Propylsulfinyl, insbesondere Methylsulfinyl und Ethylsulfinyl; Alkylsulfonyl wie Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Propylsulfonyl, iso-Propylsulfonyl, insbesondere Methylsulfonyl und Ethylsulfonyl; Carboxyl; Alkoxycarbonyl wie unter R1 genannt, insbesondere Methoxycarbonyl; Dialkylaminocarbonyl wie Dimethylaminocarbonyl, Diethylaminocarbonyl, Dipropylaminocarbonyl, Diisopropylaminocarbonyl, Dicyclopropylaminocarbonyl, Methylethylaminocarbonyl, insbesondere Dimethylaminocarbonyl und Diethylaminocarbonyl; Dialkoxyphosphonyl wie Dimethoxyphosphonyl, Diethoxyphosphonyl, Dipropoxyphosphonyl, Diisopropoxyphosphonyl, insbesondere Dimethoxyphosphonyl und Diethoxyphosphonyl; Alkaniminoxy wie insbesondere 2-Propaniminoxy; Thienyl, Furanyl, Tetrahydrofuranyl, Phthalimido, Pyridyl, Benzyloxy; Benzoyl, wobei die cyclischen Reste ihrerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl und Ethyl; Alkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy, oder Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor;

Benzyl, das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere

Methyl und Ethyl; Alkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethyl; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor, Nitro und Cyano:

- C₃-C₈-Cycloalkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Cyclopentyl und Cyclohexyl;
- Phenyl, das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl und Ethyl; Alkoxy wie unter R1 genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethyl; Halogenalkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethoxy; Alkoxycarbonyl wie vorstehend genannt, insbesondere Methoxycarbonyl; Halogen wie unter R1 genannt, insbesondere Fluor, Chlor und Brom, Nitro und Cyano;
- C₃-C₆-Alkenyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Allyl und Methallyl, C₅-C₆-Cycloalkenyl wie 2-Cyclopentenyl und 2-Cyclohexenyl, insbesondere 2-Cyclohexenyl oder C3-C6-Alkinyl wie unter R1 genannt, insbesondere Propargyl, wobei diese Reste eine der folgenden Gruppen tragen können: Hydroxy; Alkoxy wie unter R1 genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogen wie unter R1 genannt, insbesondere lod, oder Phenyl, welches seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Alkyl wie unter R1 genannt, insbesondere Methyl und Ethyl; Alkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Haloge-
- nalkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethyl; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor, Nitro oder Cyano;
 - einen fünf- bis sechsgliedrigen heterocyclischen Rest enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff wie unter R¹ genannt, insbesondere Tetrahydrofuranyl und Tetrahydropyranyl oder einen Benzotriazolrest;
 - Phthalimido; Tetrahydrophthalimido; Succinimido; Maleinimido;
 - ein Äquivalent eines Kations aus der Gruppe der Alkali- oder Erdalkalimetalle, Mangan, Kupfer, Eisen, Ammonium und substituiertes Ammonium
- oder einen Rest -N=CR6R7, wobei R6 und R7 unabhängig voneinander Wasserstoff, Alkyl wie unter R1 genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und iso-Propyl; Cycloalkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Cyclopropyl; Phenyl oder Furyl bedeuten oder zusammen eine Methylenkette der Formel -(CH₂)_m- mit m = 4 bis 7 Kettengliedern,
 - R3 Wasserstoff,
- C₁-C₆-Alkyl, wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl, Ethyl, iso-Propyl, das einen bis drei der folgenden Substituenten tragen kann: Hydroxy; Halogen wie unter R1 genannt, insbesondere Fluor und Chlor; Alkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Alkylthio wie unter R¹ genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio, oder Dialkylamino wie unter R5 genannt, insbesondere Dimethylamino;
 - Cycloalkyl wie unter R1 genannt, insbesondere Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und Isopropyl; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor, oder Halogenalkyl wie unter R1 genannt, insbesondere Trifluormethyl;
 - R4 Hydroxy;
 - Alkoxy wie unter R1 genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy;
- Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sek.-Butyl, iso-Butyl und tert.-Butyl; das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Alkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethoxy; Alkylthio wie unter R¹ genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio; Halogenalkylthio wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethylthio; Dialkylamino wie unter R¹ genannt, insbesondere Dimethylamino und Diethylamino; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor; Cycloalkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Cyclopropyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl, oder Phenyl, welches seinerseits ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen, wie bei R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor; Cyano; Nitro; Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl und Ethyl; Halogenalkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethyl; Alkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethoxy; Alkylthio wie unter R¹ genannt, insbesondere
- Methylthio und Ethylthio, oder Halogenalkylthio wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethylthio; Cycloalkyl wie unter R1 genannt, insbesondere Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl und CyclohexyL, das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Alkyl wie unter R1 genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und isopropyl; Halogenalkyl wie unter R1 genannt, insbesondere Trifluormethyl; Alkoxy wie unter R1 genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluorme
 - thoxy; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor, Nitro oder Cyano; Alkenyl oder C3-C6-Alkinyl wie unter R1 genannt, insbesondere Allyl, Methaliyl, Propargyl und 1,1-Dimethyl2-2-propinyl, das ein- bis dreimal durch Halogen wie unter R1 genannt, insbesondere Fluor und Chlor, und/oder einmal durch Phenyl substituiert sein kann, wobei der Phenylrest seinerseits eine bis drei

der folgenden Gruppen tragen kann: Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl und Ethyl: Halogenalkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethyl; Alkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethoxy; Alkylthio wie unter R¹ genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio; Halogenalkylthio wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethylthio; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor, Cyano oder Nitro;

ein 5- bis 6-gliedriger heterocyclischer Rest enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel oder Stickstoff wie unter R¹ genannt, welcher ein bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und iso-Propyl, oder Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor;

Phenyl, das eine bis vier der folgenden Gruppen tragen kann: Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und Isopropyl; Halogenalkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethyl; Alkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethylthio wie unter R¹ genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio; Halogenalkylthio wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethylthio; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor; Nitro; Cyano; Formyl; Alkanoyl wie Acetyl, Propionyl, Butyryl, insbesondere Acetyl; Halogenalkanoyl, wie Trifluoracetyl, Trichloracetyl, Pentafluorpropionyl, insbesondere Trifluoracetyl, oder Alkoxycarbonyl wie

unter R¹ genannt, insbesondere Methoxycarbonyl; Naphthyl, das ein- bis dreimal durch Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl und Ethyl, oder Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor substituiert sein kann,

20 oder

 R^3 und R^4 gemeinsam einen Rest der Struktur - $(CH_2)_n$ - Y_p - $(CH_2)_q$ -, wobei n und q 1, 2 oder 3, p 0 oder 1 und Y Sauerstoff, Schwefel oder N-Methyl wie - $(CH_2)_3$ -, - $(CH_2)_4$ -, - $(CH_2)_5$ -, -(CH

s sowie deren umweltverträglichen Salze.

Insbesondere bevorzugt sind Verbindungen la' und lb', in denen R³ Wasserstoff bedeutet sowie solche, in denen die Substituenten folgende Bedeutung haben:

Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl und 1,1-Dimethylethyl;

Methoxy, Ethoxy, Propyloxy, 1-Methylethoxy, Butyloxy, 1-Methylpropyloxy, 2-Methylpropyloxy und 1,1-Dimethylethoxy;

Difluormethoxy und Trifluormethoxy;

Methylthio, Ethylthio, Propylthio, 1-Methylethylthio, Butylthio, 1-Methylpropylthio, 2-Methylpropylthio und 1.1-Dimethylethylthio;

35 Difluormethylthio und Trifluormethylthio;

R² einen Rest -COYR⁵;

R⁵

Wasserstoff; Phthalimido; Succinimido; Maleinimido, oder einen Rest -N = CR^6R^7 ; R^6 , R^7

40 Wasserstoff;

R⁴ Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl und 1,1-Dimethylethyl; Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl und Cycloheptyl;

Beispiele für sehr aktive Verbindungen der Formeln la und lb sind in den nachstehenden Tabellen aufgeführt:

Tabelle A

 $R^{1} = R^{2}$ $R^{1} = R^{2}$ R^{2} Ia (x = 0 oder S)

		•	
R1	R2	R 3	R4
Н	COOH	н	tertButyl
F	COOH	Н	tertButyl
Cl	COOH	н	tertButyl
Methyl	COOH	н	tertButyl
Ethyl	СООН	H	tertButyl
n-Propyl	СООН	Н	tertButyl
iso-Propyl	COOH	Н	tertButyl
n-Butyl	СООН	н	tertButyl
iso-Butyl	соон	н	tertButyl
sekButyl	COOH	н	tertButyl
tertButyl	COOH	Н	tertButyl
cyclo-Propyl	COOH	Н	tertButyl
cyclo-Butyl	COOH	H	tertButyl
cyclo-Pentyl	соон	Н	tertButyl
cyclo-Hexyl	СООН	н	tertButyl
cyclo-Heptyl	COOH	H	tertButyl
cyclo-Octyl	соон	H	tertButyl
1-Methylcyclopropyl	СООН	н	tertButyl
Trifluormethyl	СООН	Н	tertButyl
Chlordifluormethyl	СООН	Н	tertButyl
Pentafluorethyl	СООН	Н	tertButyl
Methoxymethyl	СООН	Н	tertButyl
1-Methylmethoxymethyl	СООН	Н	tertButyl
1-Methylmethoxyethyl	COOH	H	tertButyl
Ethoxymethy1	COOH	Н	tertButyl
Vinyl	COOH	H	tertButyl
Allyl	COOH	Н	tertButyl
Methallyl	COOH	н	tertButyl
Crotyl	COOH	Н	tertButy
Ethinyl	СООН	Н	tertButy
Propargy1	СООН	Н	tertButy
Phenylethinyl	COOH	Н	tertButy
Methoxy	COOH	H	tertButy
Ethoxy	СООН	Н	tertButy
Trifluormethoxy	COOH	Н	tertButy
	соон	н	tertButy

55

	R1	R2	R3	R ⁴
_	Trifluormethylthio	соон	н .	tertButyl
5	Phenoxy	COOH	н	tertButyl
	4-C1-Phenoxy	СООН	н	tertButyl
	2,4-(C1,C1)-Phenoxy	COOH	н	tertButyl
	4-CF ₃ -Phenoxy	COOH	Н	tertButyl
10	Pheny l	СООН	н	tertButyl
	2-F-Phenylthio	COOH	н .	tertButyl
	3-F-Pheny l	COOH	H	tertButyl
	2,4-(F,F)-Phenyl	COOH	н	tertButyl
15	2-C1-Phenyl	COOH	Н	tertButyl
	3-C1-Phenyl	COOH	н	tertButyl
	2,4-(C1,C1)-Phenyl	COOH	н	tertButyl
	2-CH ₃ -Pheny l	COOH	н	tertButyl
20	3-CH ₃ -Phenyl	COOH	н	tertButyl
	4-CH ₃ -Phenyl	СООН	н	tertButyl
	2,4-(CH ₃ ,CH ₃)-Phenyl	COOH	н	tertButyl
	2, 4, 6-(CH ₃ , CH ₃ , CH ₃)-Phenyl	СООН	н	tertButyl
	2-CF ₃ -Phenyl	COOH	н	tertButyl
25	2-OCH ₃ -Phenyl	COOH	Н	tertButyl
	2,4-(OCH3,OCH3)-Phenyl	СООН	Н	tertButyl
	4-OCF 3-Pheny l	СООН	н	tertButyl
	4-SCH ₃ -Pheny1	СООН	н	tertButyl
30	3-SCF 3-Pheny l	СООН	н	tertButyl
	2, 4-(NO ₂ , NO ₂)-Phenyl	COOH	н	tertButyl
	4-NO ₂ -Phenyl	СООН	н	tertButyl
	2-Thienyl	СООН	н	tertButyl
35	3-Thienyl	COOH	Н	tertButyl
	2-Furanyl	СООН	н	tertButyl
	3-Furany l	COOH	н	tertButyl
	2-Tetrahydrofuranyl	COOH	н	tertButyl
40	3-Tetrahydrofuranyl	COOH	н	tertButyl
	2-Pyridyl	СООН	н	tertButyl
	3-Pyridyl	COOH	н	tertButyl
	4-Pyridyl	COOH	н	tertButyl
45	2-Tetrahydropyranyl	соон	Н	tertButyl
40	3-Tetrahydropyranyl	COOH	H	tertButyl
	4-Tetrahydropyranyl	СООН	н	tertButyl
	iso-Propoxy	СООН	H	tertButyl
	Н	СООН	Н	cyclo-Propyl
50	 F	СООН	Н	cyclo-Propyl
	Cl	COOH	Н	cyclo-Propyl
	- ·			

Phenyl 2-F-Phenylthio 3-F-Phenyl COOH H cyclo-Propyl cyclo-Propyl	R1	. R2	R3	R4
Ethyl COOH H	Makhul	COOH	н	cyclo-Propyl
COOH				
So-Floy 1				•
So-Buty COOH				-
SekButyl				<u>-</u>
tertButyl cyclo-Propyl cyclo-Propyl cyclo-Propyl cyclo-Butyl cyclo-Pentyl cyclo-Pentyl cyclo-Hexyl cyclo-Hexyl cyclo-Heptyl cyclo-Heptyl cyclo-Octyl l-Methylcyclopropyl Trifluormethyl Methoxymethyl l-Methylmethoxymethyl l-Methylmethoxymethyl looh lethoxymethyl looh lethoxy lethoxy lethinyl looh lethinyl looh lethinyl looh lethinyl looh lethinyl looh lethinyl looh lethoxy looh lethoxy lethoxy lethoxy lethoxy lethoxy lethoxy lethoxy looh lethoxy lethox				•
Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl cyclo-Butyl COOH H Cyclo-Propyl cyclo-Pentyl COOH H Cyclo-Propyl cyclo-Heptyl COOH H Cyclo-Propyl cyclo-Heptyl COOH H Cyclo-Propyl cyclo-Octyl COOH H Cyclo-Propyl cyclo-Octyl COOH H Cyclo-Propyl cyclo-Octyl COOH H Cyclo-Propyl Trifluormethyl COOH H Cyclo-Propyl Chlordifluormethyl COOH H Cyclo-Propyl Chlordifluormethyl COOH H Cyclo-Propyl Chlordifluormethyl COOH H Cyclo-Propyl Chlordifluormethyl COOH H Cyclo-Propyl L-Methylmethoxymethyl COOH H Cyclo-Propyl L-Methylmethoxymethyl COOH H Cyclo-Propyl L-Methylmethoxymethyl COOH H Cyclo-Propyl CooH Cyclo-Propyl Cy				
Cyclo-Propy Cyclo-Buty COOH	•			
Cyclo-Pentyl COOH	cyclo-Propyl			
cyclo-Hexyl cyclo-Hexyl cyclo-Octyl l-Methylcyclopropyl COOH H cyclo-Propyl cyclo-Octyl l-Methylcyclopropyl COOH H cyclo-Propyl Methoxymethyl l-Methylmethoxymethyl l-Methylmethoxyethyl COOH H cyclo-Propyl CooH Cyclo-Propyl CooH H cyclo-Propyl CooH CooH Cyclo-Propyl CooH	•			
cyclo-Heptyl cyclo-Octyl 1-Methylcyclopropyl COOH H cyclo-Propyl Trifluormethyl COOH H cyclo-Propyl Trifluormethyl COOH H cyclo-Propyl Chlordifluormethyl COOH H cyclo-Propyl Chlordifluormethyl COOH H cyclo-Propyl Pentafluorethyl COOH H cyclo-Propyl Methoxymethyl COOH H cyclo-Propyl 1-Methylmethoxymethyl COOH H cyclo-Propyl Ethoxymethyl COOH H cyclo-Propyl COOH H cyclo-Propyl Vinyl COOH H cyclo-Propyl Trifluormethoxy COOH H cyclo-Propyl COOH H cyclo-Propyl COOH H cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl COOH H cyclo-Propyl Cyclo-Prop	cyclo-Pentyl			_
cyclo-Octyl cyclo-Octyl cyclo-Propyl cyclo-Propyl cyclo-Propyl cooh H cyclo-Propyl Trifluormethyl Cooh H cyclo-Propyl Chlordifluormethyl Cooh H cyclo-Propyl Chlordifluormethyl Cooh H cyclo-Propyl Pentafluorethyl Cooh H cyclo-Propyl Methoxymethyl Cooh H cyclo-Propyl L-Methylmethoxymethyl Cooh H cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cooh H cyclo-Propyl Cycl	cyclo-Hexyl			-
1-Methylcyclopropyl 1-Methylcyclopropyl Trifluormethyl Cooh H Cyclo-Propyl Pentafluorethyl Cooh H Cyclo-Propyl Pethoxymethyl Cooh H Cyclo-Propyl Cooh H Cyclo-Propyl Pethoxymethyl Cooh H Cyclo-Propyl Pethoxymethyl Cooh H Cyclo-Propyl Cooh H Cyclo-Propyl Pethinyl Propargyl Propargyl Phenylethinyl Cooh H Cyclo-Propyl Pethoxy Cooh H Cyclo-Propyl Pethoxy Pethox	cyclo-Heptyl			
Trifluormethyl Chlordifluormethyl Chlordifluormethyl Pentafluorethyl Pentafluorethyl Pentafluorethyl COOH H Cyclo-Propyl Pentafluorethyl Pentafluorethyl Pentafluorethyl Pentafluorethyl Pentafluorethyl Pentafluorethyl COOH H Cyclo-Propyl Pentyl Pentyl Pentafluormethyl COOH H Cyclo-Propyl Pentyl Pentyl Pentyl Pentyl Propargyl Pentyl Penty	cyclo-Octyl			_
Chlordifluormethyl Pentafluorethyl Pentafluorethyl COOH H Cyclo-Propyl Methoxymethyl COOH H Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl L-Methylmethoxymethyl COOH H Cyclo-Propyl Ethoxymethyl COOH H Cyclo-Propyl Vinyl COOH H Cyclo-Propyl Vinyl COOH H Cyclo-Propyl Propargyl COOH H Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl CoOH H Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl CoOH H Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl CoOH H Cyclo-Propyl Cyclo-	1-Methylcyclopropyl			-
Pentafluormethyl Pentafluorethyl Methoxymethyl 1-Methylmethoxymethyl COOH H Cyclo-Propyl 1-Methylmethoxymethyl COOH H Cyclo-Propyl 1-Methylmethoxyethyl COOH H Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl Vinyl COOH H Cyclo-Propyl Allyl COOH H Cyclo-Propyl Crotyl COOH H Cyclo-Propyl Crotyl COOH H Cyclo-Propyl Ethinyl COOH H Cyclo-Propyl Propargyl Phenylethinyl COOH H Cyclo-Propyl CoOH H Cyclo-Propyl Methoxy COOH H Cyclo-Propyl Ethoxy COOH H Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Trifluormethoxy COOH H Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Trifluormethoxy COOH H Cyclo-Propyl Trifluormethylthio COOH H Cyclo-Propyl Cyclo-Pr	Trifluormethyl			<u> </u>
Methoxymethyl 1-Methylmethoxymethyl 1-Methylmethoxyethyl COOH H Cyclo-Propyl 1-Methylmethoxyethyl COOH H Cyclo-Propyl Ethoxymethyl COOH H Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl Crotyl COOH H Cyclo-Propyl Ethinyl COOH H Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl Ethinyl COOH H Cyclo-Propyl Cy	Chlordifluormethyl	соон		-
1-Methylmethoxymethyl COOH H Cyclo-Propyl 1-Methylmethoxyethyl COOH H Cyclo-Propyl Ethoxymethyl COOH H Cyclo-Propyl Vinyl COOH H Cyclo-Propyl Allyl COOH H Cyclo-Propyl Crotyl COOH H Cyclo-Propyl Ethinyl COOH H Cyclo-Propyl Propargyl COOH H Cyclo-Propyl Propargyl COOH H Cyclo-Propyl Methoxy COOH H Cyclo-Propyl Ethoxy COOH H Cyclo-Propyl Ethoxy COOH H Cyclo-Propyl Trifluormethoxy COOH H Cyclo-Propyl Methylthio COOH H Cyclo-Propyl Trifluormethylthio COOH H Cyclo-Propyl Phenoxy COOH H Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl	Pentafluorethyl	СООН	Н	
1-Methylmethoxymethyl 1-Methylmethoxyethyl Ethoxymethyl COOH H Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl Allyl Methallyl COOH H Cyclo-Propyl Crotyl COOH H Cyclo-Propyl Ethinyl COOH H Cyclo-Propyl Propargyl Phenylethinyl COOH H Cyclo-Propyl Methoxy COOH H Cyclo-Propyl Ethoxy Trifluormethoxy Trifluormethoxy Methylthio Trifluormethylthio Phenoxy COOH H Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl CoOH H Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl Cycl	Methoxymethyl	СООН	Н	_
1-Methylmethoxyethyl Ethoxymethyl COOH H Cyclo-Propyl Vinyl COOH H Cyclo-Propyl Allyl COOH H Cyclo-Propyl Methallyl Crotyl Crotyl Ethinyl Propargyl Propargyl Phenylethinyl Methoxy Ethoxy COOH H Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl Methoxy Ethoxy COOH H Cyclo-Propyl Trifluormethoxy Methylthio Trifluormethylthio Phenoxy COOH H Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl Cyclo-	1-Methylmethoxymethyl	COOH	Н	-
Ethoxymethyl Vinyl COOH H Cyclo-Propyl Allyl COOH H Cyclo-Propyl Methallyl COOH H Cyclo-Propyl Crotyl COOH H Cyclo-Propyl Crotyl Ethinyl COOH H Cyclo-Propyl Propargyl Phenylethinyl COOH H Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl Methoxy COOH H Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Trifluormethoxy Methylthio COOH H Cyclo-Propyl Trifluormethylthio COOH H Cyclo-Propyl		COOH	н	
Vinyl Allyl COOH H Cyclo-Propyl Methallyl COOH H Cyclo-Propyl Crotyl COOH H Cyclo-Propyl Crotyl Ethinyl COOH H Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Methoxy COOH H Cyclo-Propyl		COOH	Н	
Methallyl COOH H Cyclo-Propyl Crotyl Cthinyl COOH H Cyclo-Propyl Crotyl COOH H Cyclo-Propyl Crotyl COOH H Cyclo-Propyl		COOH	H	=
Methallyl Crotyl Crotyl Ethinyl Propargyl Propargyl Phenylethinyl Methoxy Ethoxy Trifluormethoxy Methylthio Trifluormethylthio Phenoxy 4-Cl-Phenoxy Phenoxy Phenyl A-CF ₃ -Phenoxy Phenyl Phenyl Phenyl Phenyl Phenyl Phenyl Phenoxy Phenyl Phenoxy Phenyl Phenoxy Phenyl Phenoxy Phenoxy Phenyl Phenoxy Phenoxy Phenyl Phenyl Phenoxy Phenyl Ph	-	COOH	H	
Crotyl Ethinyl COOH H Cyclo-Propyl Propargyl Phenylethinyl Methoxy Ethoxy COOH H Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl Ethoxy Trifluormethoxy Methylthio Trifluormethylthio Phenoxy COOH H Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl	_	COOH	Н	
Ethinyl Propargyl Propargyl Phenylethinyl Methoxy Ethoxy COOH Trifluormethoxy Methylthio Trifluormethylthio Phenoxy Phenoxy COOH Phenoxy COOH COOH Cyclo-Propyl CoOH Cyclo-Propyl CoOH Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl CoOH Cyclo-Propyl CoOH Cyclo-Propyl CoOH Cyclo-Propyl CoOH Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl CoOH Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl CoOH Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl CoOH Cyclo-Propyl		COOH	Н	-
Propargyl Phenylethinyl Phenylethinyl Phenylethinyl Phenylethinyl Phenylethinyl Phenylethinyl Phenylethinyl Phenyl Phenyl Phenoxy Phenyl Phenoxy Phenyl Phenoxy Phenyl Phenoxy Phenyl Phenoxy Phenyl Pheny		COOH	н	
Phenylethinyl Methoxy Ethoxy Trifluormethoxy Methylthio Trifluormethylthio Phenoxy 4-Cl-Phenoxy 2,4-(Cl,Cl)-Phenoxy Phenyl Phenyl 2-F-Phenyl Methoxy COOH H Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl		СООН	H	_
MethoxyCOOHHCyclo-PropylEthoxyCOOHHCyclo-PropylTrifluormethoxyCOOHHCyclo-PropylMethylthioCOOHHCyclo-PropylTrifluormethylthioCOOHHCyclo-PropylPhenoxyCOOHHCyclo-Propyl4-Cl-PhenoxyCOOHHCyclo-Propyl2,4-(Cl,Cl)-PhenoxyCOOHHCyclo-Propyl4-CF3-PhenoxyCOOHHCyclo-Propyl2-F-PhenylthioCOOHHCyclo-Propyl3-F-PhenylCOOHHCyclo-PropylCOOHHCyclo-PropylCOOHHCyclo-Propyl	-	COOH	Н	_
Ethoxy Trifluormethoxy Methylthio Trifluormethylthio COOH H Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl CooH H Cyclo-Propyl		COOH	н	-
Trifluormethoxy Methylthio Trifluormethylthio Phenoxy 4-Cl-Phenoxy 2,4-(Cl,Cl)-Phenoxy 4-CF ₃ -Phenoxy Phenyl 2-F-Phenyl 3-F-Phenyl	•	COOH	н	-
Methylthio COOH H Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl Phenoxy COOH H Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl Cyclo-Propy	-	COOH	н	
Trifluormethylthio COOH H Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl Cy	********	СООН	H	•
Phenoxy 4-Cl-Phenoxy 2,4-(Cl,Cl)-Phenoxy 4-CF ₃ -Phenoxy Phenyl 2-F-Phenylthio 3-F-Phenyl		COOH	н	~
4-Cl-Phenoxy COOH H Cyclo-Propyl 2,4-(Cl,Cl)-Phenoxy COOH H Cyclo-Propyl 4-CF ₃ -Phenoxy COOH H Cyclo-Propyl Phenyl COOH H Cyclo-Propyl 2-F-Phenylthio COOH H Cyclo-Propyl 3-F-Phenyl COOH H Cyclo-Propyl		СООН	н	
2,4-(Cl,Cl)-Phenoxy COOH H cyclo-Propyl 4-CF ₃ -Phenoxy COOH H cyclo-Propyl Phenyl COOH H cyclo-Propyl 2-F-Phenylthio COOH H cyclo-Propyl 3-F-Phenyl COOH H cyclo-Propyl	_		н	-
2,4-(c1,c1)-Phenoxy COOH H cyclo-Propyl Phenyl COOH H cyclo-Propyl COOH H cyclo-Propyl COOH H cyclo-Propyl 3-F-Phenyl COOH H cyclo-Propyl	_		н	•
Phenyl 2-F-Phenylthio 3-F-Phenyl COOH H Cyclo-Propyl COOH H Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl	•			-
2-F-Phenylthio 3-F-Phenyl cyclo-Propyl cyclo-Propyl	_			cyclo-Propyl
3-F-Phenyl COOH H cyclo-Propyl				cyclo-Propyl
3-r-rieny: cyclo-Propy!			H ⁻	cyclo-Propyl
	3-F-Pheny l 2, 4-(F, F)-Pheny l	СООН	н	cyclo-Propyl

R1	R2	R3	R4
2.01.0homu3	СООН	н	cyclo-Propyl
2-C1-Pheny1 3-C1-Pheny1	COOH	H	cyclo-Propyl
2,4-(C1,C1)-Phenyl	COOH	., Н	cyclo-Propyl
• • • • • • • • • • • • • • • • • • • •	COOH	H	cyclo-Propyl
2-CH ₃ -Phenyl	COOH	H	cyclo-Propyl
3-CH ₃ -Phenyl	COOH	н	cyclo-Propyl
4-CH ₃ -Phenyl	СООН	н	cyclo-Propyl
2, 4-(CH ₃ , CH ₃)-Phenyl	COOH	н	cyclo-Propyl
2, 4, 6- (CH ₃ , CH ₃ , CH ₃)-Pheny l	COOH	н Н	cyclo-Propyl
2-CF ₃ -Phenyl	СООН	 Н	cyclo-Propyl
2-OCH ₃ -Phenyl	COOH	н	cyclo-Propyl
2,4-(OCH ₃ ,OCH ₃)-Phenyl	COOH	 H	cyclo-Propyl
4-OCF ₃ -Phenyl	COOH	н	cyclo-Propyl
4-SCH ₃ -Phenyl 3-SCF ₃ -Phenyl	COOH	н	cyclo-Propyl
<u> </u>	СООН	н	cyclo-Propyl
2, 4-(NO ₂ , NO ₂)-Phenyl	СООН	 H	cyclo-Propyl
4-NO ₂ -Phenyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
2-Thienyl	COOH	. н	cyclo-Propyl
3-Thienyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
2-Furanyl 3-Furanyl	COOH	н	cyclo-Propyl
2-Tetrahydrofuranyl	СООН	H	cyclo-Propyl
3-Tetrahydrofuranyl	COOH	н	cyclo-Propyl
2-Pyridyl	COOH	н .	cyclo-Propyl
3-Pyridyl	COOH	н	cyclo-Propyl
4-Pyridyl	COOH	н	cyclo-Propyl
2-Tetrahydropyranyl	COOH	 Н	cyclo-Propyl
3-Tetrahydropyranyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
4-Tetrahydropyranyl	COOH	н	cyclo-Propyl
iso-Propoxy	COOH	Н	cyclo-Propyl
H	COOH	Methy 1	tertButyl
 F	СООН	Methyl	tertButyl
C1	СООН	Methy i	tertButyl
Methyl	СООН	Methyl	tertButyl
Ethyl	СООН	Methyl	tertButyl
n-Propyl	СООН	Methyl	tertButyl
iso-Propyl	СООН	Methyl	tertButyl
n-Butyl	СООН	Methyl	tertButyl
iso-Butyl	COOH	Methyl	tertButyl
sekButyl	СООН	Methyl	tertButyl
tertButyl	COOH	Methyl	tertButyl
cyclo-Propyl	COOH	Methyl	tertButyl
cyclo-Butyl	СООН	Methyl	tertButyl

R1	R2	R 3	R4
cyclo-Pentyl	СООН	Methyl	tertButyl
cyclo-Pentyl cyclo-Hexyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
cyclo-Heptyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
	COOH	iso-Propyl	tertButyl
cyclo-Octyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
1-Methylcyclopropyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Trifluormethyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Chlordifluormethyl Pentafluorethyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
•	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Methoxymethyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
1-Methylmethoxymethyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
1-Methylmethoxyethyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Ethoxymethyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Vinyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Allyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Methallyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Crotyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Ethinyl		, -	tertButyl
Propargyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Phenylethinyl	COOH	iso-Propyl iso-Propyl	tertButyl
Methoxy	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Ethoxy			tertButyl
Trifluormethoxy	COOH	iso-Propyl	cyclo-Propyl
H	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
F	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
C1	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
Methyl	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
Ethyl	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
n-Propyl	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
iso-Propyl	COOH	Methyl .	cyclo-Propyl
n-Butyl	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
iso-Butyl	COOH	iso-Propyl iso-Propyl	cyclo-Propyl
sekButyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
cer cbucy i	COOH		cyclo-Propyl
cyclo-Propyl	COOH	iso-Propyl	cyclo-Propyl
cyclo-Butyl	COOH	iso-Propyl iso-Propyl	cyclo-Propyl
cyclo-Pentyl	COOH		cyclo-Propyl
cyclo-Hexyl	COOH	Methy l	cyclo-Propyl
cyclo-Heptyl	COOH	Methy l	cyclo-Propyl
cyclo-Octyl	COOH	Methy l	cyclo-Propyl
1-Methylcyclopropyl	COOH	Methy l	cyclo-Propyl
Trifluormethyl	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
Chlordifluormethyl	COOH	Methyl	cyclo-Propy (

R1	R2	R 3	R4
Pentafluorethyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
Methoxymethy l	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
1-Methylmethoxymethyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
1-Methylmethoxyethyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
Ethoxymethyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
Vinyl	соон	iso-Propyl	cyclo-Propyl
Allyl	COOH	iso-Propyl	cyclo-Propyl
Methallyl	COOH	iso-Propyl	cyclo-Propyl
Crotyl	COOH	Methy l	cyclo-Propyl
Ethinyl	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
Propargyl	соон	Methy l	cyclo-Propyl
Phenylethinyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
Methoxy	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
Ethoxy	соон	Methyl	cyclo-Propyl
Trifluormethoxy	СООН	Methyl	cyclo-Propyl

Tabelle B

Ib (X = 0 oder S)

H		R1	R2	R3	R4
To COOH H tertButy C1 COOH H tertButy Ethy Ethoxy Etho		ш	СООН	н	tertButyl
C1 Methyl Ethyl C00H H tertButyl Ethyl C00H H tertButyl Ethyl C00H H tertButyl S0-Propyl C00H H tertButyl S0-Propyl C00H H tertButyl S0-Butyl C00H H tertButyl S0-Butyl C00H H tertButyl S0-Butyl C00H H tertButyl S0-Butyl C00H H tertButyl EtertButyl C00H H tertButyl C00H H tert	15				tertButyl
Methyl	. •	•		Н	tertButyl
Ethyl COOH H tertButyl iso-Propyl COOH H tertButyl iso-Propyl COOH H tertButyl iso-Propyl COOH H tertButyl iso-Butyl COOH H tertButyl iso-Butyl COOH H tertButyl tertButyl tertButyl COOH H tertButyl tertButyl COOH H tert				н	tertButyl
1		•		Н	tertButyl
iso-Propyl				н	tertButyl
n-Butyl iso-Butyl COOH H tertButyl iso-Butyl COOH H tertButyl COOH H tertButyl ter	20			н	tertButyl
iso-Butyl COOH		• •	СООН	Н	tertButyl
25 SekButyl COOH H tertButyl tertButyl cyclo-Propyl COOH H tertButyl cyclo-Propyl COOH H tertButyl cyclo-Pentyl COOH H tertButyl cyclo-Pentyl COOH H tertButyl cyclo-Hexyl COOH H tertButyl cyclo-Hexyl COOH H tertButyl cyclo-Hexyl COOH H tertButyl cyclo-Octyl COOH H tertButyl cyclo-Octyl COOH H tertButyl cyclo-Octyl COOH H tertButyl COOH TertButyl COOH H tertButyl COOH TertButyl COOH H tertButyl Tert		•		н	tertButyl
tertButyl		<u> </u>		н	tertButyl
cyclo-Propyl cyclo-Butyl cyclo-Butyl cyclo-Pentyl cyclo-Pentyl cyclo-Hexyl cyclo-Hexyl cyclo-Hexyl cyclo-Octyl cyclo-Octyl l-Methylcyclopropyl COOH H tertButyl Chlordifluormethyl Pentafluorethyl l-Methylmethoxymethyl COOH H tertButyl COOH H tertButyl LertButyl L	25			н	tertButyl
Cyclo-Butyl COOH H tertButyl		_	СООН	н	tertButyl
Cyclo-Pentyl COOH H tertButyl		• · · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	СООН	Н	tertButyl
cyclo-Hexyl cyclo-Heptyl cyclo-Octyl l-Methylcyclopropyl COOH H tertButyl l-Methylcyclopropyl COOH H tertButyl Chlordifluormethyl COOH H tertButyl Chlordifluormethyl COOH H tertButyl Pentafluorethyl Methoxymethyl COOH H tertButyl Methoxymethyl COOH H tertButyl L-Methylmethoxymethyl COOH H tertButyl L-Methylmethoxyethyl COOH H tertButyl COOH H tertButyl COOH H tertButyl Vinyl COOH H tertButyl Vinyl COOH H tertButyl Crotyl Ethinyl COOH H tertButyl Ethinyl COOH H tertButyl COOH H tertButyl Ethinyl Propargyl Phenylethinyl Methoxy Ethoxy COOH H tertButyl		-	соон	н	tertButyl
cyclo-Heptyl cyclo-Octyl COOH H cyclo-Octyl 1-Methylcyclopropyl COOH H certButyl Trifluormethyl COOH H certButyl Chlordifluormethyl COOH H certButyl Chlordifluormethyl COOH H certButyl Pentafluorethyl Methoxymethyl COOH H cooh H certButyl T-Methylmethoxymethyl COOH H cooh H certButyl Crotyl COOH H cooh H certButyl Crotyl COOH H cooh H certButyl	30		СООН	Н	tertButyl
cyclo-Octyl 1-Methylcyclopropyl COOH H tertButyl Trifluormethyl Chlordifluormethyl Chlordifluormethyl Chlordifluormethyl Chlordifluormethyl COOH H tertButyl		. •	СООН	н	tertButyl
1-Methylcyclopropyl COOH H tertButyl Chlordifluormethyl COOH H tertButyl Pentafluorethyl COOH H tertButyl Methoxymethyl COOH H tertButyl 1-Methylmethoxymethyl COOH H tertButyl 1-Methylmethoxyethyl COOH H tertButyl Ethoxymethyl COOH H tertButyl Vinyl COOH H tertButyl Vinyl COOH H tertButyl TertButyl COOH H tertButyl TertButyl COOH H tertButyl TertB		•	СООН	н	tertButyl
Trifluormethyl Chlordifluormethyl Chlordifluormethyl Chlordifluormethyl Cooh H TertButyl Pentafluorethyl Methoxymethyl I-Methylmethoxymethyl I-Methylmethoxyethyl Ethoxymethyl Vinyl 40 Allyl Vinyl Cooh H TertButyl Cooh H TertButyl Vinyl Cooh H TertButyl Cooh H TertButyl TertButyl Cooh H TertButyl TertButyl Cooh H TertButyl Cooh H TertButyl TertButyl Cooh H TertButyl TertButyl Cooh H TertButyl TertButyl Cooh H TertButyl		-		Н	tertButyl
Chlordifluormethyl Pentafluorethyl Rethoxymethyl COOH H CO	35			н	tertButyl
Pentafluorethyl Methoxymethyl COOH H tertButyl 1-Methylmethoxymethyl COOH H tertButyl 1-Methylmethoxyethyl Ethoxymethyl Vinyl Allyl Methallyl COOH H tertButyl COOH H tertButyl Trifluormethoxy COOH H tertButyl TertButyl TertButyl COOH H tertButyl			соон	н	tertButyl
Methoxymethyl COOH H tertButyl 1-Methylmethoxyethyl COOH H tertButyl Ethoxymethyl COOH H tertButyl Vinyl COOH H tertButyl 45 Allyl COOH H tertButyl Methallyl COOH H tertButyl Crotyl COOH H tertButyl Ethinyl COOH H tertButyl Ethinyl COOH H tertButyl Fhenylethinyl COOH H tertButyl Methoxy COOH H tertButyl Methoxy COOH H tertButyl Ethioxy COOH H tertButyl Trifluormethoxy COOH H tertButyl				н	tertButyl
1-Methylmethoxymethyl COOH H tertButyl Ethoxymethyl COOH H tertButyl Vinyl COOH H tertButyl Allyl COOH H tertButyl Methallyl COOH H tertButyl Crotyl COOH H tertButyl Ethinyl COOH H tertButyl Ethinyl COOH H tertButyl Propargyl COOH H tertButyl Phenylethinyl COOH H tertButyl Methoxy COOH H tertButyl Ethoxy COOH H tertButyl Trifluormethoxy COOH H tertButyl			СООН	н	tertButyl
1-Methylmethoxyethyl COOH H tertButyl Ethoxymethyl COOH H tertButyl Vinyl COOH H tertButyl Allyl COOH H tertButyl Methallyl COOH H tertButyl Crotyl COOH H tertButyl Ethinyl COOH H tertButyl Propargyl COOH H tertButyl Phenylethinyl COOH H tertButyl Methoxy COOH H tertButyl Ethoxy COOH H tertButyl Trifluormethoxy COOH H tertButyl	40	•	соон	н	tertButyl
Ethoxymethyl Vinyl COOH H tertButyl tertButyl COOH H Methallyl Crotyl Ethinyl Propargyl Phenylethinyl Methoxy Ethoxy Trifluormethoxy COOH H COOH H tertButyl	70		соон	Н	tertButyl
Vinyl COOH H tertButyl Methallyl Crotyl Ethinyl Propargyl Phenylethinyl Methoxy Ethoxy Trifluormethoxy COOH H COOH H TertButyl Trifluormethoxy COOH H TertButyl		-	СООН	н	tertButyl
Allyl COOH H tertButyl COOH H tertButyl Crotyl COOH H tertButyl Ethinyl COOH H tertButyl Propargyl COOH H tertButyl Phenylethinyl COOH H tertButyl Methoxy COOH H tertButyl tertButyl Trifluormethoxy COOH H tertButyl		<u>-</u>	соон	н	tertButyl
Methallyl Crotyl Ethinyl Propargyl Phenylethinyl Methoxy Ethoxy Trifluormethoxy Methallyl COOH H TertButyl TCOOH H TertButyl TCOOH H TertButyl TCOOH H TertButyl		-	соон	н	tertButyl
Crotyl Ethinyl Propargyl Phenylethinyl Methoxy Ethoxy Trifluormethoxy COOH H C	45	•	СООН	н	tertButyl
Ethinyl COOH H tertButyl Propargyl COOH H tertButyl Phenylethinyl COOH H tertButyl Methoxy COOH H tertButyl Ethoxy COOH H tertButyl Trifluormethoxy COOH H tertButyl			СООН	н	tertButyl
Propargyl COOH H tertButyl Phenylethinyl COOH H tertButyl Methoxy COOH H tertButyl Ethoxy COOH H tertButyl Trifluormethoxy COOH H tertButyl		_	СООН	н	
Phenylethinyl COOH H tertButyl Methoxy COOH H tertButyl Ethoxy COOH H tertButyl Trifluormethoxy COOH H tertButyl			соон	н	tertButyl
Methoxy COOH H tertButyl Ethoxy COOH H tertButyl Trifluormethoxy COOH H tertButyl	50		СООН	н	tertButyl
Ethoxy COOH H tertButyl Trifluormethoxy COOH H tertButyl		· -	соон	н	tertButyl
Trifluormethoxy COOH H tertButyl		•	СООН	н	_
ss cook in tertbutyi	-	•	СООН	Ĥ	
	55	Methylthio	соон	н	tertButyl

5	R1	R2	R3	R4
	Trifluormethylthio	COOH	Н	tertButyl
	Phenoxy	COOH	Н	tertButyl
10	4-Cl-Phenoxy	COOH	H	tertButyl
10	2,4-(Cl,Cl)-Phenoxy	СООН	Н	tertButyl
	4-CF ₃ -Phenoxy	COOH	Н	tertButyl
	Pheny l	COOH	Н	tertButyl
	2-F-Phenylthio	COOH	Н	tertButyl
15	3-F-Pheny l	COOH	Н	tertButyl
	2,4-(F,F)-Phenyl	COOH	Н	tertButyl
	2-Cl-Phenyl	COOH	Н	tertButyl
	3-Cl-Phenyl	СООН	H	tertButyl
20	2,4-(Cl,Cl)-Phenyl	COOH	Н	tertButyl
	2-CH ₃ -Pheny l	COOH	Н	tertButyl
	3-CH ₃ -Pheny l	COOH	Н	tertButyl
	4-CH ₃ -Phenyl	COOH	Н	tertButyl
25	2, 4-(CH ₃ , CH ₃)-Pheny l	COOH	Н	tertButyl
	2, 4, 6-(CH ₃ , CH ₃ , CH ₃)-Pheny l	COOH	Н	tertButyl
	2-CF ₃ -Pheny l	СООН	Н	tertButyl
	2-OCH ₃ -Pheny l	СООН	Н	tertButyl
30	2, 4-(OCH ₃ , OCH ₃)-Pheny l	СООН	Н	tertButyl
50	4-OCF ₃ -Pheny l	COOH	H	tertButyl
	4-SCH ₃ -Pheny l	COOH	H	tertButyl
	3-SCF ₃ -Pheny1	COOH	Н	tertButyl
	2, 4-(NO2, NO2)-Pheny 1	СООН	Н	tertButyl
35	4-NO ₂ -Pheny l	COOH	Н	tertButyl
	2-Thieny l	COOH	Н	tertButyl
	3-Thienyl	COOH	Н	tertButyl
	2-Furanyl	COOH	Н	tertButyl
40	3-Furanyl	COOH	Н	tertButyl
	2-Tetrahydrofuranyl	COOH	Н	tertButyl
	3-Tetrahydrofuranyl	COOH	Н	tertButyl
	2-Pyridyl	COOH	н	tertButyl
45	3-Pyridyl	COOH	Н	tertButyl
	4-Pyridyl	COOH	Н	tertButyl
	2-Tetrahydropyranyl	COOH	н	tertButyl
	3-Tetrahydropyranyl	COOH	Н	tertButyl
50	4-Tetrahydropyranyl	COOH	Н	tertButyl
	iso-Propoxy	COOH	н	tertButyl
	Н	COOH	Н	cyclo-Propyl
_	F	COOH	<u> </u>	cyclo-Propyl
<i>55</i>	Cl	СООН	H	cyclo-Propyl
55	Methyl	COOH	Н	cyclo-Propyl

	R1	R2	R 3	R4
5				
	Ethyl	COOH	H	cyclo-Propyl
	n-Propyl	COOH	H	cyclo-Propyl
	iso-Propyl	COOH	H	cyclo-Propyl
10	n-Buty l	СООН	Н	cyclo-Propyl
	iso-Butyl	СООН	н	cyclo-Propyl
	sekButyl	СООН	H	cyclo-Propyl
	tertButyl	СООН	н	cyclo-Propyl
15	cyclo-Propyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
	cyclo-Butyl	СООН	Н	cyclo-Propyl
	cyclo-Pentyl	СООН	Н	cyclo-Propyl
	cyclo-Hexyl	СООН	Н	cyclo-Propyl
20	cyclo-Heptyl	СООН	Н	cyclo-Propyl
20	cyclo-Octyl	соон	н	cyclo-Propyl
	1-Methylcyclopropyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
	Trifluormethyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
	Chlordifluormethyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
25	Pentafluorethyl	COOH	H	cyclo-Propyl
	Methoxymethy 1	СООН	Н	cyclo-Propyl
	1-Methylmethoxymethyl	СООН	н	cyclo-Propyl
	1-Methylmethoxyethyl	COOH	н	cyclo-Propyl
30	Ethoxymethy 1	СООН	н	cyclo-Propyl
	Vinyl	COOH	н	cyclo-Propyl
	Allyl	COOH	н	cyclo-Propyl
	Methallyl	COOH	н	cyclo-Propyl
35	Crotyl	соон	н	cyclo-Propyl
	Ethinyl	СООН	н	cyclo-Propyl
	Propargyl	соон	н	cyclo-Propyl
	Phenylethinyl	СООН	Н	cyclo-Propyl
40	Methoxy	COOH	н	cyclo-Propyl
70	Ethoxy	COOH	н	cyclo-Propyl
	Trifluormethoxy	соон	н	cyclo-Propyl
	Methylthio	соон	н	cyclo-Propyl
	Trifluormethylthio	СООН	н .	cyclo-Propyl
45	Phenoxy	COOH	Н	cyclo-Propyl
	4-C1-Phenoxy	COOH	н	cyclo-Propyl
	2,4-(Cl,Cl)-Phenoxy	СООН	н	cyclo-Propyl
	4-CF ₃ -Phenoxy	СООН	н	cyclo-Propyl
50	Pheny 1	СООН	H	cyclo-Propyl
	2-F-Phenylthio	СООН	н	cyclo-Propyl
	3-F-Phenyl	СООН	н	cyclo-Propyl
-	2,4-(F,F)-Phenyl	соон	Ĥ	cyclo-Propyl
55	2-C1-Phenyl	СООН	н	cyclo-Propyl
	Z-CI-FIICHJI			•

_	R1	R2	R3	R4
5				
	3-C1-Pheny1	COOH	Н	cyclo-Propyl
	2, 4-(C1, C1)-Phenyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
	2-CH ₃ -Phenyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
10	3-CH ₃ -Phenyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
	4-CH ₃ -Pheny l	COOH	Н	cyclo-Propyl
	2,4-(CH ₃ ,CH ₃)-Phenyl	COOH	н	cyclo-Propyl
	2, 4, 6-(CH ₃ , CH ₃ , CH ₃)-Phenyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
15	2-CF ₃ -Pheny l	COOH	н	cyclo-Propyl
	2-OCH ₃ -Phenyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
	2, 4-(OCH ₃ , OCH ₃)-Phenyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
	4-OCF ₃ -Pheny l	COOH	Н	cyclo-Propyl
20	4-SCH ₃ -Phenyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
	3-SCF ₃ -Phenyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
	2,4-(NO ₂ ,NO ₂)-Phenyl	СООН	H	cyclo-Propyl
	4-NO ₂ -Phenyl	COOH	н	cyclo-Propyl
25	2-Thienyl	COOH	н	cyclo-Propyl
20	3-Thienyl	COOH	H	cyclo-Propyl
	2-Furanyl	COOH	H	cyclo-Propyl
	3-Furanyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
	2-Tetrahydrofuranyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
30	3-Tetrahydrofuranyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
	2-Pyridyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
	3-Pyridyl	COOH	H	cyclo-Propyl
	4-Pyridyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
35	2-Tetrahydropyranyl	COOH	н	cyclo-Propyl
	3-Tetrahydropyranyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
	4-Tetrahydropyranyl	COOH	н	cyclo-Propyl
	iso-Propoxy	COOH	н	cyclo-Propyl
40	H	COOH	Methyl .	tertButyl
	F	COOH	Methyl	tertButyl
	Cl	COOH	Methyl	tertButyl
	Methyl	соон	Methyl	tertButyl
45	Ethyl	COOH	Methyl	tertButyl
	n-Propyl	COOH	Methyl	tertButyl
	iso-Propyl	COOH	Methyl	tertButyl
	n-Butyl	COOH	Methyl	tertButyl
50	iso-Butyl	COOH	Methyl	tertButyl
50	sekButyl	COOH	Methy l	tertButyl
	tertButyl;	COOH	Methy l	tertButyl
	cyclo-Propyl	COOH	Methy1	tertButyl
	cyclo-Butyl	COOH	Methy 1	tertButyl
55	cyclo-Pentyl	COOH	Methyl	tertButyl

R1	R2	R3	R4
		•	
cyclo-Hexyl	СООН	iso-Propyl	tertButyl
cyclo-Heptyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
cyclo-Octyl	СООН	iso-Propyl	tertButyl
1-Methylcyclopropyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Trifluormethyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Chlordifluormethyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Pentafluorethyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Methoxymethyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
1-Methylmethoxymethyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
1-Methylmethoxyethyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Ethoxymethy l	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Vinyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Allyl	СООН	iso-Propyl	tertButyl
Methallyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Crotyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Ethinyl	СООН	iso-Propyl	tertButyl
Propargyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Phenylethinyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Methoxy	СООН	iso-Propyl	tertButyl
Ethoxy	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Trifluormethoxy	COOH	iso-Propyl	tertButyl
н	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
F	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
Cl	COOH	Methy l	cyclo-Propyl
Methyl	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
Ethyl	COOH	Methy l	cyclo-Propyl
n-Propyl	СООН	Methy l	cyclo-Propyl
iso-Propyl	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
n-Butyl	COOH	iso-Propyl	cyclo-Propyl
iso-Butyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
sekButyl	COOH	iso-Propyl	cyclo-Propyl
tertButyl	СООН	iso-Propyl	tertButyl
cyclo-Propyl	COOH	iso-Propyl	cyclo-Propyl
cyclo-Butyl	COOH	iso-Propyl	cyclo-Propyl
cyclo-Pentyl	COOH	iso-Propyl	cyclo-Propyl
cyclo-Hexyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
cyclo-Heptyl	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
cyclo-Octyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
1-Methylcyclopropyl	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
Trifluormethyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
Chlordifluormethyl	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
Pentafluorethyl	COOH	Methyl	cyclo-Propyl

<u>R1</u>	R 2	R3 .	R4
Methoxymethy l	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
1-Methylmethoxymethyl	COOH	iso-Propyl	cyclo-Propyl
1-Methylmethoxyethyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
Ethoxymethy l	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
Vinyl	COOH	iso-Propyl	cyclo-Propyl
Allyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
Methallyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
Crotyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
Ethinyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
Propargy l	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
Phenylethinyl	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
Methoxy	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
Ethoxy	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
Trifluormethoxy	СООН	Methy1	cyclo-Propyl

5	_	> ×	o s	0 S	o s	0 S	o s	0 \$	o s	s 0	s 0	0 S	o S	o s	0 S	0 S	0 S	0 S	o s	o s	0 S
15	<u>e</u>		2-butinyl		C3H5) 2	uo ou	imino	imino		thanimino	13) 2	H ₃) 3I ⁻					Н3) з	С(СН3)2	5)2	0СН3)2	H5) 2
20	- X X X X X X X X X X X X X X X X X X X	RS	4-Hydroxy-2-butinyl	N=C (C 2H5) 2	N=C(cyclo-C ₃ H ₅)	2-Butanimino	Cyclohexanimino	Cyclooctanimino	N=CH-C6H5	2-Furyl-methanimino	CH2CH2N(CH3)2	CH ₂ CH ₂ N ⁺ (CH ₃)	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ Cl	CH ₂ CH ₂ CN	CH ₂ CC1 ₃	CH ₂ CH ₂ Si (CH ₃)	CH ₂ CH ₂ 0-N=C(CH ₃) ₂	CH2PO(0C2H5)2	сн(сн3)сн(осн3)	CH2-CON(C2H5) 2
30	bzw. R1/																				
35	. 4 20 E	R4	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl
40 45		R3	=	I	I	I	I	=	I	I	I	I	I	I	I	I	I	I	x	I	I
- 50															_	ropyl	ropyl	ropyl	ropyl	ropyl	ropyl
55		12	Ch lor	Chlor	Chlor	Chlor	Ch lor	Chlor	Methyl	Methyl	Methyl	Methyl	Methyl	Methyl	Methyl	iso-Propy	iso-Propyl	iso-Propy	1so-Propy	iso-Propy	iso-Propy

55	45 50		40	35	25 30	20	15	10	5	
Læ		83	4	;	•	R.		•	×	> -
										_
iso-Propyl		I	tertButy	ıtyl		Benzyl			S	0
cyclo-Propyl		I	tertButy	ıtyl		2, 4-(Cl, Cl)-Benzyl	-Benzyl		S	0
cyclo-Propyl		I	tertButyl	ıtyl		3-Pyridyl-methyl	ethyl		S	0
cyclo-Propyl		I	tertButy	ıtyl		2-Thienyl-methyl	ethyl		S	0
cyclo-Propyl		I	tertButy	ıtyl		2-Tetrahydr	2-Tetrahydrofuranyl-methyl	ıyı	S	0
cyclo-Propyl		I	tertButyl	ıtyl		2-Furanyl-methyl	ethyl		S	0
cyclo-Propyl		I	tertButyl	ıtyl		2-Pyridyl-methyl	ethyl		s	0
cyclo-Propyl		Ŧ	tertButyl	ıtyl		Pheny l			S	0
Allyl		I	tertButy	ıtyl		4-F-Phenyl			S	0
Allyl		I	tertButy	ıtyl		4-Trifluorm	4-Trifluormethylphenyl		s	0
Allyl		I	tertButy	ıtyl		2-NO ₂ -4-F-Pheny l	heny l		S	0
Allyl		I	tertButy	ıtyl		3, 5-(CF ₃ , CF ₃)-Phenyl	3)-Phenyl		s	0
Allyl		I	tertButyl	ıtyl		4-OCH ₃ -Phenyl	yl		S	0
Allyl		I	tertButy	ıtyl		4-0CF ₃ -Pheny	y1		S	0
Allyl		I	tertButy	ıtyl		4-NHCOCH ₃ -Phenyl	henyl		s	0
Ethinyl		Ξ	tertButy	ıtyl		2-Tetrahydropyrany	opyranyl		s	0
Ethinyl		Ŧ	tertButy	ıtyl		2-Tetrahydropyrany	opyranyl		s	0
Ethinyl		I	tertButyl	ıtyl		1-Benzotriazolyl	zolyl		S	0
Ethinyl		I	tertButy	ıtyl		Methy1			s	0
Ethinyl		I	tertButyl	ıty).		Ethyl			s	0
Ethinyl		I	tertButy	ıtyl		n-Propyl			s	0
Ethinyl		Ξ	tertButy	ıtyl		iso-Propyl			S	0
Methoxy		I	tertButy	ıtyl		n-Butyl			S	0
Methoxy		×	tertButy	ıtyl		iso-Butyl			S	. 0
Methoxy		I	tertButy	ıtyl		sekButyl			S	0

50 55	4 0 4 5	35	30	25	20	10		5	
R1	R3	R4			R5		×	^	
40 H	=	tertButvl			tertButvl		v	-0	
Methoxy	: =	tertButyl	-		cyclo-Hexyl		S	•	
Methoxy	I	tertButyl			Cyclopropylmethyl	nethyl	S	0	
Methoxy	Ξ	tertButyl			Ethoxymethy		S	0	
4-Cl-Phenoxy	I	tertButyl			2-Methoxy-ethoxy-methyl	thoxy-methyl	S	0	
4-C1-Phenoxy	I	tertButyl			Benzyloxymethyl	thyl	S	•	
4-Cl-Phenoxy		tertButyl			(4-Brombenzoyl)-methyl	oyl)-methyl	S	0	
4-C1-Phenoxy	I	tertButyl			(4-Methoxybo	(4-Methoxybenzoyl)-methyl	S	0	
4-C1-Phenoxy	I	tertButyl			Phthalimidomethy	nethyl	S	0	
4-C1-Phenoxy	x	tertButyl			Methylthiomethy.	ethy.l	S	0	
4-C1-Phenoxy	I	tertButyl		•	2-Thiomethyl-ethyl	l-ethyl	S	0	
Phenylthio	I	tertButyl			сн(сен ₅)соосн ₃	CH3		0	
Phenylthio	I	tertButyl			Phenylethyl		S	0	
Pheny 1 thio	Ė	tertButyl			4-F-Phenylethyl	thyl	S	0	
Pheny lthio	I	tertButyl			Phthalimido		S	0	
Pheny I thio	I	tertButyl			Tetrahydrophthalimido	nthalimido	S	0	
Pheny Ithio	I	tertButyl			Maleinimido		S	0	
Pheny I thio	I	tertButyl			Succinimido		S	0	
2, 4-(C1, C1) -Pheny l	I	tertButyl		•	Piperidino		S	0	
2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl	I	tertButyl			+ 1 7		S	0	
2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl	I	tertButyl			+eN		S	0	
2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl	Ξ	tertButyl			+ +		S	0	
2,4-(C1,C1)-Phenyl	I	tertButyl			NH ⁴ +		S	0	
2, 4-(C1, C1)-Phenyl	Ξ	tertButyl			Diisopropylammonium	ammon i um	S	0	
2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl	I	tertButyl			2-Hydroxyeti	2-Hydroxyethyl-ammonium	S	0	

R1 2-Thienyl 2-Thienyl	# I F	40	R4 tert, -Butyl	30	25	R5 Allyl	15	10	5 × 0 0	> 0
	= = =	ב ני ני	tertButyl tertButyl tertButyl		ĒŻĒ	metnallyl 2-Chlorallyl Propargyl			ທ່ທ່	000
-	I I I	t c	tertButyl cyclo-Propyl		ਲ ਵਾਂ ਡੇ	3-Iodpropargyl 4-Hydroxy-2-butinyl	itinyl .		ທຸທຸພ	000
	: I I	cyc cyc	cyclo-Propyl		żż	n-c(c2m5/2 N=C(cyclo-C3H5)2 2-Butanimino	1) 2		n vs vs	
	* *	cyc cyc	cyclo-Propyl		. S S	Cyclohexanimino Cyclooctanimino	<u> </u>		တ တ	
	I I	cyc	cyclo-Propyl cyclo-Propyl	·	ž ~	N=CH-C ₆ H ₅ 2-Furyl-methanimino	imino		s s	0 0
	I I	cyc	cyclo-Propyl cyclo-Propyl		5 5	CH2CH2N(CH3)2 CH2CH2N+(CH3)3	L		S S	0 0
	I I	cyc	cyclo-Propyl cyclo-Propyl		ರ ರ	CH ₂ CF ₃ CH ₂ CH ₂ C1			s s	0 0
dethyl Iso-Pronvl	r	cyc	cyclo-Propyl		ಕ ಕ	CH ₂ CH ₂ CN			S L	0 (
so-Propyl	=	cyc	cyclo-Propyl		5 5	СН ₂ СС 13 СН ₂ СН ₂ S i (СН ₃) ₃			n s	
so-Propyl so-Propyl	I I	ָרָ כָּ	cyclo-Propyl cyclo-Propyl		င် ငံ	CH ₂ CH ₂ O-N=C(CH ₃) ₂ CH ₂ PO(OC ₂ H ₅) ₂	3) 2		s s	0 0
so-Propy	x x	C C	cyclo-Propyl cyclo-Propyl		ರ ರ	CH(CH ₃)CH(OCH ₃) CH ₂ -CON(C ₂ H ₅) ₂) 2		s s	0 0
so-Propyl	I	C	cyclo-Propyl		Be	Benzy!			S	0

55	45 50	40	35	30	25	20	15	10	5	
r.		R3	R4			RS			×	٨
										_
cyclo-Propyl	ly.	I	cyclo-Propyl			2, 4-(C1, C1)-Benzyl	-Benzyl		S	0
cyclo-Prop	ıyı	I	cyclo-Propyl			3-Pyridyl-methyl	nethyl		S	0
cyclo-Propyl	181	I	cyclo-Propyl			2-Thienyl-methyl	nethy1		S	0
cyclo-Prop	lyl	I	cyclo-Propyl			2-Tetrahydr	2-Tetrahydrofuranyl-methyl	ethyl	S	0
cyclo-Propyl	ly1	I	cyclo-Propyl			2-Furanyl-methy	nethy		S	0
cyclo-Propy	ıyı	I	cyclo-Propyl			2-Pyridyl-methyl	nethyl		S	0
cyclo-Propy	lyl	I	cyclo-Propyl			Phenyl			s	0
Allyl		I	cyclo-Propyl			4-F-Phenyl			S	0
Allyl		I	cyclo-Propyl			4-Trifluorn	4-Trifluormethylphenyl	_	S	0
Allyl		I	cyclo-Propyl			2-NO ₂ -F-Phenyl	any 1		s	0
Allyl		I	cyclo-Propyl			3, 5-(CF3, CF3)-Phenyl	3)-Phenyl		s	0
Allyl		I	cyclo-Propyl			4-OCH ₃ -Phenyl	ıyı		S	0
Allyl		I	cyclo-Propyl			4-OCF 3-Pheny l	ıyı		S	0
Allyl		I	cyclo-Propyl			4-NHCOCH ₃ -Phenyl	henyl		S	0
Ethinyl		I	cyclo-Propyl			2-Tetrahydropyrany	opyranyl		s	0
Ethinyl		Ξ	cyclo-Propyl			2-Tetrahydrofurany	ofuranyl		S	0
Ethinyl		I	cyclo-Propyl			l-Benzotriazolyl	ızolyl		S	0
Ethinyl		I	cyclo-Propyl			Methyl			s	0
Ethinyl		I	cyclo-Propyl			Ethyl			S	0
Ethinyl		I	cyclo-Propyl			n-Propyl			S,	0
Ethinyl		I	cyclo-Propyl			iso-Propyl			S	0
Methoxy		I	cyclo-Propyl			n-Butyl			S	0
Methoxy		I	cyclo-Propyl			iso-Butyl			S	0
Methoxy		I	cyclo-Propyl			sekButyl			S	0
Methoxy		I	cyclo-Propyl			tertButyl	_		S	0

	50	45	35	30	25	20	15	10		5
H Cyclo-Propy Cyclo-Hexy S		R3	R4			R5			×	>
H cyclo-Propy C chyclo-Propy H cyclo-Propy H cyclo-Propy C chyclo-Propy C chycl		I	cyclo-Propyl			cyclo-Hexyl			S	
H cyclo-Propy Ethoxymethy S C-Methoxy-ethoxy-methy S C-Methoxy-ethoxy-methy S C-Methoxy-ethoxy-methy S C-Methoxy-ethoxy-methy S C-Methoxybenzoy S C-Methoxybenzoy C-Methoxybenzoy C-Methoxybeny S C-Methoxybeny C-Methoxybeny S C-Met		I	cyclo-Propyl			Cyclopropyl	methyl		S	0
H Cyclo-Propy 2-Methoxy-methy 5		I	cyclo-Propyl			Ethoxymethy	-		S	0
H cyclo-Propyl Benzyloxymethyl S H cyclo-Propyl (4-Brombenzoyl)-methyl S H cyclo-Propyl (4-Methoxybenzoyl)-methyl S H cyclo-Propyl Phthalimidomethyl S H cyclo-Propyl 2-Thiomethyl-ethyl S H cyclo-Propyl CH(C6H5)COOCH3 S H cyclo-Propyl Phenylethyl S H cyclo-Propyl Phthalimido S H cyclo-Propyl Na+ S H cyclo-Propyl Na+ S H cyclo-Propyl Na+ S H cyclo-Propy		I	cyclo-Propyl			2-Methoxy-e	thoxy-methyl	_	S	0
H Cyclo-Propy (4-Brombenzoy)-methy S		I	cyclo-Propyl			Benzyloxyme	thyl		S	0
H cyclo-Propyl (4-Methoxybenzoyl)-methyl S H cyclo-Propyl Phthalimidomethyl S H cyclo-Propyl Aethylthiomethyl S H cyclo-Propyl CH(CeHs)COOCH3 H cyclo-Propyl Phthalimido S H cyclo-Propyl S H c		I	cyclo-Propyl			(4-Brombenz	oyl)-methyl		S	0
H cyclo-Propyl Methylthiomethyl S H cyclo-Propyl Methylthiomethyl S H cyclo-Propyl 2-Thiomethyl S H cyclo-Propyl CH(C ₆ H ₅)COOCH ₃ H cyclo-Propyl CH(C ₆ H ₅)COOCH ₃ S H cyclo-Propyl Phenylethyl S H cyclo-Propyl Phthalimido S H cyclo-Propyl Maleinimido S H cyclo-Propyl Succinimido S H cyclo-Propyl Piperidimo S H cyclo-Propyl R ⁺ H cyclo-Propyl Sicopropylammonium S H cyclo-Propyl S H		Ŧ	cyclo-Propyl			(4-Methoxyb	enzoyl)-meth	ny 1	S	0
H cyclo-Propyl 2-Thiomethyl S H cyclo-Propyl 2-Thiomethyl ethyl S H cyclo-Propyl CH(C ₆ H ₅)COCH ₃ S H cyclo-Propyl CH(C ₆ H ₅)COCH ₃ S H cyclo-Propyl Phenylethyl S		I	cyclo-Propyl			Phthalimido	methyl		S	0
H cyclo-Propyl CH(CgHs)COCCH3 S CH(CGHs)COCCH3 CH(CGHs)COCCH	•	Ξ	cyclo-Propyl			Methylthiom	nethy l		S	0
H cyclo-Propyl CH(C ₆ H ₅)COOCH ₃ H cyclo-Propyl Phenylethyl S H cyclo-Propyl Phenylethyl S H cyclo-Propyl Phenylethyl S H cyclo-Propyl Phenylethyl S H cyclo-Propyl Priphyl Succinimido S H cyclo-Propyl Priphyl Succinimido S H cyclo-Propyl Priphyl Succinimido S H cyclo-Propyl Priphyl S H cyclo-Propyl R ⁺ H cyclo-Propyl Ma ⁺ H cyclo-Propyl Ma ⁺ H cyclo-Propyl Diisopropylammonium S H cyclo-Propyl S		I	cyclo-Propyl			2-Thiomethy	1-ethyl		S	0
H cyclo-Propyl Phenylethyl S H cyclo-Propyl 4-F-Phenylethyl S H cyclo-Propyl Phthalimido S H cyclo-Propyl Tetrahydrophthalimido S H cyclo-Propyl Succinimido S H cyclo-Propyl Piperidimo S H cyclo-Propyl Li ⁺ H cyclo-Propyl Na ⁺ H cyclo-Propyl Na ⁺ H cyclo-Propyl Nha ⁺ H cyclo-Propyl Diisopropylammonium S H cyclo-Propyl Diisopropylammonium S H cyclo-Propyl S ² -Hydroxyethyl-ammonium S H cyclo-Propyl S ³ -Hydroxyethyl-ammonium S H cyclo-Propyl S ³ -Hydroxyethyl-ammonium S		I	cyclo-Propyl			сн(с ₆ н ₅)соо	СН3		S	0
H cyclo-Propyl 4-F-Phenylethyl S H cyclo-Propyl Phthalimido S H cyclo-Propyl Tetrahydrophthalimido S H cyclo-Propyl Succinimido S H cyclo-Propyl Piperidimo S H cyclo-Propyl Li ⁺ H cyclo-Propyl Na ⁺ H cyclo-Propyl Na ⁺ H cyclo-Propyl Nh4 ⁺ H cyclo-Propyl Diisopropylammonium S H cyclo-Propyl S		Ξ	cyclo-Propyl			Phenylethyl			S	0
H cyclo-Propyl Tetrahydrophthalimido S H cyclo-Propyl Tetrahydrophthalimido S H cyclo-Propyl Succinimido S H cyclo-Propyl Piperidimo S H cyclo-Propyl Li ⁺ H cyclo-Propyl Na ⁺ H cyclo-Propyl NH ₄ ⁺ H cyclo-Propyl Diisopropylammonium S H cyclo-Propyl Diisopropylammonium S H cyclo-Propyl Allyl S		=	cyclo-Propyl			4-F-Phenyle	thyl		S	0
H cyclo-Propyl Tetrahydrophthalimido S H cyclo-Propyl Succinimido H cyclo-Propyl Succinimido H cyclo-Propyl Piperidimo H cyclo-Propyl Na ⁺ H cyclo-Propyl Na ⁺ H cyclo-Propyl Diisopropylammonium S H cyclo-Propyl Diisopropylammonium S H cyclo-Propyl S-Hydroxyethyl-ammonium S H cyclo-Propyl S-Hydroxyethyl-ammonium S H cyclo-Propyl S-Hydroxyethyl-ammonium S		I	cyclo-Propyl			Phthalimido			S	0
H cyclo-Propyl Succinimido S H cyclo-Propyl Succinimido S H cyclo-Propyl Li ⁺ H cyclo-Propyl Na ⁺ H cyclo-Propyl K ⁺ H cyclo-Propyl NH ₄ ⁺ H cyclo-Propyl Diisopropylammonium S H cyclo-Propyl Allyl S		I	cyclo-Propyl			Tetrahydrop	hthalimido		S	•
H cyclo-Propyl Succinimido S H cyclo-Propyl Li ⁺ H cyclo-Propyl Na ⁺ H cyclo-Propyl K ⁺ H cyclo-Propyl NH ₄ ⁺ H cyclo-Propyl Diisopropylammonium S H cyclo-Propyl S		I	cyclo-Propyl			Maleinimido			S	0
H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl Disopropylammonium R cyclo-Propyl H cyclo-Propyl Allyl		I	cyclo-Propyl			Succinimido			S	0
H cyclo-Propyl Allyl	٦,	I	cyclo-Propyl			Piperidimo			S	0
H cyclo-Propyl K ⁺ H cyclo-Propyl K ⁺ H cyclo-Propyl Diisopropylammonium S H cyclo-Propyl 2-Hydroxyethyl-ammonium S H cyclo-Propyl S	7	I	cyclo-Propyl			Li+			S	0
1 H cyclo-Propyl K ⁺ 1 H cyclo-Propyl NH ₄ ⁺ 1 H cyclo-Propyl Diisopropylammonium S 1 H cyclo-Propyl Allyl S	_	I	cyclo-Propyl			Na+			S	0
1 H cyclo-Propyl NH4 ⁺ 1 H cyclo-Propyl Diisopropylammonium S 1 H cyclo-Propyl 2-Hydroxyethyl-ammonium S H cyclo-Propyl Allyl	۲	I	cyclo-Propyl			+			S	0
1 H cyclo-Propyl Diisopropylammonium S 1 H cyclo-Propyl 2-Hydroxyethyl-ammonium S H cyclo-Propyl Allyl	رر	I	cyclo-Propyl			+ * HN			S	0
l H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl	ر ا	I	cyclo-Propyl			Diisopropyl	ammon i um		S	0
	کا	Ξ	cyclo-Propyl			2-Hydroxyet	hyl-ammonium.	_	S	0
		I	cyclo-Propyl			Allyl			S	0

50 - 55	4 5	40	35	30	25	20	16	10	5	_
R1	R		R4			R5			×	>
2-Thienvl	I		cyclo-Propyl			Methallyl			S	70
2-Thlenyl	I		cyclo-Propyl			2-Chlorally	_		ဟ	0
2-Thienyl	I		cyclo-Propyl			Propargyl			S	0
2-Thienyl	=		cyclo-Propyl			3-lodpropargyl	lyl		S	0
	I		tertButyl			-N=C(CH3)2			ဟ	0
1 4.	=		tertButyl	•		-N=C(CH3)2			S	0
ວ	Ξ		tertButyl			-N=C(CH3)2			S	0
Methyl	I		tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			ဟ	0
Ethyl			tertButyl			-N=C(CH3)2			S	0
n-Propyl	I		tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
iso-Propyl	I		tertButyl			-N=C(CH3)2			S	0
n-Butyl	Ξ		tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
iso-Butyl	I		tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
sek!-Butyl	Ξ		tertButyl			-N=C(CH3)2			s	0
tertButyl	I	_	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
cyclo-Propyl	I	_	tertButyl			-N=C(CH3)2			S	0
cyclo-Butyl	I		tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
cyclo-Pentyl	I		tertButyl			-N=C(CH3)2			S	0
cyclo-Hexyl	I	_	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
cyclo-Heptyl	I	_	tertButyl			-N=C(CH3)2			S	0
cyclo-Octyl	I	_	tertButyl			-N=C(CH3)2			S	0
1-Methylcyclopropyl	Ξ -	_	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
Trifluormethyl	I	_	tertButyl			-N=C(CH3)2			S	0
Chlordifluormethyl	I	_	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
Pentafluormethyl	I	-	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0

55	50	45	40		35	30	25	20	15	10	5	
R1		·	R 3	R.4			25				×	>
			:	•	•		á	1 1070			·	_
i so-Propoxy			I	tertButy	utyı	-		-N=C(CH3)2			n (
Methoxymethyl	-		I	tertButy	utyl		7	-N=C(CH3)2			'n	•
1-Methylmethoxymethyl	oxymethy l		I	tertButy	utyl		*	-N=C(CH ₃) ₂			S	0
1-Methylmethoxyethyl	oxyethyl		Ŧ	tertButy	utyl		Ÿ	-N=C(CH3)2			S	0
Ethoxymethy!			I	tertButy	utyl		Ÿ	-N=C (CH3) 2			S	0
Vinyl			I	tertButy	utyl		Ÿ	-N=C (CH3) 2			S	0
Allyl			I	tertButy	utyl		Ÿ	-N=C(CH ₃) ₂	•		S	0
Methallyl			I	tertButy	utyl		Ÿ-	-N=C(CH ₃) ₂			S	0
Crotyl			I	tertButy	utyl		Ÿ	-N=C (CH3) 2			S	0
Ethinyl			I	tertButy	utyl		ž	-N=C(CH3)2			s	0
Propargyl			I	tertButy	utyl		Ÿ	-N=C (CH3) 2			S	0
Phenyleethinyl	nyl		Ŧ	tertButy	utyl		Ÿ	-N=C(CH ₃) ₂			S	0
Methoxy	•		Ŧ	tertButy	utyl		Ÿ	-N=C(CH3)2			S	0
Ethoxy			Ė	tertButy	utyl		Ÿ	-N=C (CH3) 2			S	0
Trifluormethoxy	hoxy		Ŧ	tertButy	utyl		Ÿ	-N=C (CH3) 2			S	0
Methylthio			Ŧ	tertButy	utyl	٠	Ÿ	-N=C (CH3) 2			S	0
Trifluormethylthio	hylthio		Ŧ	tertButy	lutyl		Ÿ	-N=C (CH ₃) ₂			S	0
Phenoxy	1		I	tertButy	lutyl		Ÿ	-N=C(CH3)2			S	0
4-Cl-Phenox	>-		Ŧ	tertButy	utyl		Ÿ	-N=C (CH3) 2			s	0
2, 4-(C1, C1)-Phenoxy	-Phenoxy		Ŧ	tertButy	luty 1		Ž	-N=C (CH3) 2			S	0
4-CF ₁ -Phenoxy	λx		I	tertButy	lutyl		Ž	-N=C (CH3) 2			s	0
Phenyl	•		Ŧ	tertButy	luty l		Ÿ	-N=C (CH3) 2			s	0
2-F-Phenylthio	hio		Ŧ	tertButy	outyl		Ž	-N=C (CH3) 2			S	0
3-F-Phenyl		ě	I	tertButy	lutyl		Ž	-N=C (CH3) 2			s	0
2, 4-(F, F)-Phenyl	heny l		I	tertButy	sutyl		Ž	-N=C(CH ₃) ₂			S	0

55	4 5	40	35	30	25	20	15	10	5	
7		7	Š			<u>د</u>			*	>
2		2	¥			2			•	-
2-C1-Phenyl		I	tertButyl	•		-N=C(CH ₃) ₂		,	S	~ o
3-C1-Pheny	_	I	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
2, 4-(C1, C1)-Phenyl	-Phenyl	I	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
2-CH ₃ -Phen ₃		I	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
3-CH3-Phen	-	I	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
4-CH ₃ -Phen		I	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			s	0
2, 4- (CH 1, CI	H ₃)-Phenyl	I	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
2, 4, 6- (CH ₃ ,	2, 4, 6-(CH ₃ , CH ₃ , CH ₃)-Phenyl	I	tertButyl			-N=C(CH3)2			S	0
· 2-CF 1-Phen		. =	tertButyl			-N=C(CH3)2			S	0
2-0CH ₃ -Phe	nyl	I	tertButyl			-N=C(CH3)2			ဟ	0
2, 4- (OCH ₃ , (OCH ₃)-Phenyl	Ŧ	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
4-0CF 3-Phe	4-OCF 1-Phenyl	I	tertButyl			-N=C(CH3)2			S	0
4-SCH ₁ -Phe	nyl	I	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
3-SCF 3-Phenyl	nyl	±	tertButyl			-N=C (CH3)2			S	0
2.4-(N02, N	0,)-Phenyl	I	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
4-NO 2-Phen	4-NO-Phenyl	I	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
2-Thienyl		I	tert,Butyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
3-Thienyl		I	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
2-Furanyl		I	tertButyl			-N=C(CH3)2			S	0
3-Furanyl		I	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
2-Tetrahydrofurany	lrofurany l	, =	tertButyl			-N=C(CH3)2			s	0
3-Tetrahydrofurany	irofuranyl	I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			s	0
2-Pyridyl		I	tertButyl			-N=C(CH3)2			S	0
3-Pyridyl		I	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			s	0
4-Pyridyl		I	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0

50 55		45	40	35	30	25	20	15	10		5	
R1			2	R4			R5			×	>	- 1
											_	
2-Tetrahydropyranyl	oyranyl		=	tertButyl			-N=C (CH3) 2			S	0	
3-Tetrahydropyranyl	oyranyl		I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			S	0	
4-Tetrahydropyranyl	pyranyl		I	tertButyl			-N=C (CH ₃) ₂			S	0	
I			Ŧ	cyclo-Propyl			-N=C (CH3) 2			S	0	
L			I	cyclo-Propyl			-N=C (CH ₃) 2			S	0	
c ₁			I	cyclo-Propyl			-N=C (CH3) 2			S	0	
Methyl			I	cyclo-Propyl			-N=C (CH3) 2			S	0	
Ethyl			Ŧ	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0	
n-Propyl			Ŧ	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0	
iso-Propyl			=	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0	
n-Butyl			I	cyclo-Propyl			-N≖C(CH3)2			ဟ	0	
iso-Butyl			×	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			ဟ	0	
sek.⊤Butyl			Ŧ	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0	
tertButyl			I	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0	
cyclo-Propyl			×	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0	
cyclo-Butyl			=	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			ဟ	0	
cyclo-Pentyl	•		I	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0	
cyclo-Hexyl		•	I	cyclo-Propyl			N=C(CH3)2			S	0	
cyclo-Heptyl			I	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0	
cyclo-Octyl			=	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0	
1-Methylcyclopropyl	opropyl		I	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂		٠	S		
Trifluormethyl	۲		I	cyclo-propyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0	
Chlordifluormethyl	methyl		Ŧ	cyclo-Propyl			-N=C (CH ₃) ₂			S	0	
Pentafluorethyl	hy 1		=	cyclo-Propyl			-N=C (CH3) 2			S	0	
iso-Propoxy			I	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0	

55	45 50		40	35	30	25	20	15	10	5	
Ç.		æ	4				R5		į	×	-
Methoxymethyl	lyl	I	cycl	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
1-Methylmethoxymethyl	thoxymethyl	I	cycl	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0
1-Methylmethoxyethyl	hoxvethyl	=	cycl	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
Ethoxymethyl	, =	I	cycl	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0
Vinvl	•	Ŧ	cycl	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0
A11v1	٠	*	cycl	cyclo-Propyl			-N=C (CH3) 2			S	0
Methallyl		=	cycl	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			ဟ	0
Crotvl		I	cycl	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0
Fthiny		I	cycl	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
Propardyl		I	cycl	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
Phenylethinyl	n	I	cycl	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0
Methoxy	•	I	cycl	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0
Ethoxy		I	cyc1	cyclo-Propyl	-		-N=C(CH3)2			S	0
Trifluormethoxy	thoxy	I	cycl	cyclo-Propyl			-N=C (CH3) 2			S	0
Methylthio	•	I	cycl	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
Trifluormethylthio	thylthio	I	cycl	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0
Phenoxy.		I	cycl	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
4-C1-Phenoxy	××	I	cycl	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0
2.4-(C1.C1)-Phenoxy)-Phenoxy	Ŧ	cyc	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			ဟ	0
4-CF Phenoxy	AXO	I	cyc	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
Phenyl	•	Ξ	cyc	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
2-F-Phenvlthio	thio	Ξ	cyc	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
3-F-Phenyl		Ξ	CAC	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			လ	0
2.4-(F.F)-Phenyl	-Pheny l	I	cyc	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
2-C1-Phenyl	, 1,	I	cyc	cyclo-Propyl			-N=C (CH ₃) ₂			S	0

4 5 50	40	35	30	25	20	15	10	3	5
R1	8	R4			8			×	>
									_
3-C1-Phenyl	I	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl	Ŧ	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0
2-CH ₃ -Phenyl	I	cyclo-Propyl			-N=C (CH3) 2			S	0
3-CH ₃ -Pheny1	I	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0
4-CH ₃ -Phenyl	Ŧ	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			ဟ	0
2, 4-(CH ₃ , CH ₃)-Phenyl	I	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
2, 4, 6-(CH ₃ , CH ₃ , CH ₃)-Pheny	H	cyclo-Propyl			-N=C (CH3) 2			S	0
2-CF ₃ -Phenyl	I	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0
2-OCH ₃ -Phenyl	I	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0
2, 4-(OCH ₃ , OCH ₃)-Phenyl	I	cyclo-Propyl			-N=C (CH3) 2			ß	0
4-0CF ₃ -Phenyl	I	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0
4-SCH ₃ -Phenyl	=	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0
3-SCF ₃ -Phenyl	I	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0
2, 4-(NO ₂ , NO ₂)-Pheny l	Ŧ	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0
4-NO ₂ -Pheny l	I	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0
2-Thienyl	I	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			တ	0
3-Thienyl	I	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0
2-Furanyl	I	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
3-Furanyl	I	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
2-Tetrahydrofuranyl	I	cyclo-Propyl			-N=C (CH3) 2			S	0
3-Tetrahydrofuranyl	I	cyclo-Propyl			-N=C (CH3) 2			s	0
2-Pyridyl	I	cyclo-Propyl			-N=C (CH3) 2			S	0
3-Pyridyl	I	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			s	0
4-Pyridyl	I	cyclo-Propyl			-N=C (CH3) 2			S	0
2-Tetrahydropyranyl	I	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0

55	50	45	40	35	25 30		20	15	10	5	
R1			R3	R4		RS				×	_
										(-
3-Tetrahydropyranyl	pyranyl		I	cyclo-Propyl		-N=C (CH3)	CH3)2			S	0
4-Tetrahydropyranyl	pyranyl		I	cyclo-Propyl		-N=C(CH3)	СН3)2			S	0
chlor	,		Ŧ	Methyl		I				s	0
Chlor			Ŧ	Ethyl		I				S	0
Chlor			Ŧ	n-Propyl		I				s	0
Chlor			Ŧ	iso-Propyl		I				s	0
Chlor			x	n-Butyl		I				s	0
Chlor			Ŧ	iso-Butyl		I				S	0
Methy 1			Ŧ	sekButyl		I				s	0
Methyl			I	n-Pentyl		I				S	0
Methyl			I	2-Pentyl		I				S	0
Methyl			Ŧ	3-Pentyl		I				S	0
Methyl			=	n-Hexyl		±				S	0
Methyl			÷	2-Hexyl		I				S	0
iso-Propyl			±	3-Hexyl		I				S	0
iso-Propyl			I	2-Methyl-2-pentyl	lk	I				S	0
iso-Propyl			I	cyclo-Propylmethy∣	hyl	I				S	0
iso-Propyl			I	cyclo-Butyl		I				S	0
iso-Propyl			I	cyclo-Pentyl		=			•	S	0
iso-Propyl			=	cyclo-Hexyl		I				S	0
cyclo-Propy			I	1-Methylcyclohexyl	xyl	I				S	0
cyclo-Propy			I	3-Trifluormethylcyclohexyl	lcyclohexyl	I				s	0
cyclo-Propy	_		I	Allyl		I				S	0
cyclo-Propyl	<u>-</u> -		Ŧ	1-Buten-3-yl		I				s	0
cyclo-Propyl	Ļ		I	Crotyl		I				S	0

50 55	45	40	35	25 30	20	15	10	5	
R1		R3	R4		20			×	>
cyclo-Propyl		I	Propargyl		=			S	- 0
Allyl		I	1-Butin-3-yl		Œ			S	0
Allyl		I	3-Methyl-1-butin-3-y	in-3-yl	I			S	0
Allyl		=	2-Pentin-4-yl		I		•	S	0
Allyl		I	Benzyl		I			ဟ	0
Allyl		I	2-Phenylethyl		I			S	0
Allyl		I	2-Methylthioethyl	ly1	I			S	0
Ethinyl	٠	I	2-Chlorethyl	٠	I			ဟ	0
Ethinyl		I	2-Methoxyethyl		I			S	0
Ethinyl		I	2-(N, N-Dimethylamino)ethyl	lamino)ethyl	I			S	0
Ethinyl		I	Pheny1		I			S	0
Ethinyl		I	2-CH ₃ -Phenyl		I			S	0
Ethinyl		I	4-CH3-Phenyl		I			S	0
Methoxy		I	2, 4-(CH ₃ , CH ₃)-Phenyl	Phenyl	I			S	0
Methoxy		I	2, 3, 5-(CH ₃ , CH ₃ , CH ₃)-Pheny	, CH ₃)-Pheny l	I	•		S	0
Methoxy		I	3-CF ₃ -Phenyl		x			S	0
Methoxy		I	3-F-Phenyl		I			S	0
Methoxy		I	2-C1-Phenyl		I			S	0
Methoxy		I	4-Cl-Phenyl		I			S	0
4-C1-Phenoxy		I	2, 4-(F, F)-Pheny l	7.1	I			S	0
4-Cl-Phenoxy		I	2, 3, 5-(c1, c1, c1)-Pheny	l)-Phenyl	I			S	0
4-C1-Phenoxy		I	2-CN-Pheny1		I			S	0
4-C1-Phenoxy		I	2-OCH ₃ -Phenyl		=			s	0
4-Cl-Phenoxy		I	2, 3-(OCH ₃ , OCH ₃)-Phenyl)-Phenyl	×			S	0
4-C1-Phenoxy		Ξ	3, 4, 5- (OCH ₃ , OC	3, 4, 5-(OCH ₃ , OCH ₃ , OCH ₃)-Phenyl	I			S	0

2,4-(SCH3,SCH3)-Phenyl H 2-SCF3-Phenyl H 4-NO2-Phenyl H 2,4-(NO2,NO2)-Phenyl H 2-CHO-Phenyl H 3-COCH3-Phenyl H 3-COCH3-Phenyl H 1-Naphthyl H 2-Naphthyl H 2-Naphthyl H 3-Tetrahydropyranyl H 4-Tetrahydropyranyl H 5-CH3-2-Thiazolyl H 6-CH3-5-COOH-2-Thiazolyl H 8-CH3-5-COOH-2-Thiazolyl H 8-CH3-5-COOH-3-Thiazolyl H 8-CH3-
4-NO ₂ -Phenyl 2,4-{NO ₂ ,NO ₂ }-Phenyl 2-CHO-Phenyl 3-COCH ₃ -Phenyl 1-Naphthyl 2-Naphthyl 2-Naphthyl 4-Tetrahydrofuranyl 4-Tetrahydropyranyl 4-CH ₃ -2-Thiazolyl 4-CH ₃ -5-COOH-2-Thiazolyl Ethyl iso-Propyl iso-Propyl
3-COCH ₃ -Phenyl 3-COCF ₃ -Phenyl 1-Naphthyl 2-Naphthyl 4-Tetrahydrofuranyl 4-Tetrahydropyranyl 2-Thiazolyl 5-CH ₃ -2-Thiazolyl 4-CH ₃ -5-COOH-2-Thiazolyl Ethyl iso-Propyl iso-Propyl
1-Naphthyl 2-Naphthyl 2-Naphthyl Piperidino 3-Tetrahydrofuranyl 4-Tetrahydropyranyl 2-Thiazolyl 5-CH ₃ -2-Thiazolyl 4-CH ₃ -5-COOH-2-Thiazolyl methyl iso-Propyl iso-Propyl iso-Butylyl
Piperidino 3-Tetrahydrofuranyl 4-Tetrahydropyranyl 2-Thiazolyl 5-CH ₃ -2-Thiazolyl 4-CH ₃ -5-COOH-2-Thiazolyl Methyl Ethyl n-Propyl iso-Propyl iso-Butylyl
4-Tetrahydropyranyl 2-Thiazolyl 5-CH ₃ -2-Thiazolyl 4-CH ₃ -5-C00H-2-Thiazolyl Methyl r-Propyl iso-Propyl iso-Propyl
D-CH ₃ -2-iniazolyi 4-CH ₃ -5-COOH-2-Thiazolyl Methyl Ethyl n-Propyl iso-Propyl iso-Butyl
Methyl Ethyl n-Propyl iso-Propyl n-Butyl iso-Butylyl
n-Propyl iso-Propyl n-Butyl iso-Butyllyl
n-Butyl iso-Butylyl
iso-Butylyl

40 En Cal	30	20 20	10
,			
n-Pentyl	tyl	I	• 7
2-Penty	[h	Ŧ	
3-Penty			•,
n-Hexy]		=	••
2-Hexyl		×	
3-Hexyl		=	
Methyl		-N=C(CH ₃) ₂	
Ethyl		-N=C(CH ₃) ₂	••
n-Propyl	=	-N=C(CH ₃) ₂	
iso-Propyl	pyl	-N=C(CH ₃) ₂	•
n-Butyl		-N=C(CH ₃) ₂	
iso-Butyl		-N=C(CH ₃) ₂	
sekButyl	=	-N=C(CH ₃) ₂	
n-Pentyl		-N=C(CH ₃) ₂	
2-Penty		-N=C(CH ₃) ₂	••
3-Pentyl		-N=C(CH ₃) ₂	••
n-Hexyl		-N=C(CH ₃) ₂	
2-Hexyl		-N=C(CH ₃) ₂	
3-Hexyl	-	-N=C(CH ₃) ₂	
2-Methyl	2-Methyl-2-pentyl	-N=C(CH ₃) ₂	
cyclo-Pr	cyclo-Proplymethyl	-N=C(CH ₃) ₂	.,
cyclo-Butyl	utyl	-N=C(CH ₃) ₂	
cyclo-Penty	entyl	-N=C(CH3)2	
cyclo-Hexyl	Hexyl	-N=C(CH ₃) ₂	S
1-Methylcyclohexy		-N=C(CH ₂),	S

50 55	45	40	35	25 30	20	15	10	5	
					,			:	,
R1		R3	R4		R5			×	_
				•				•	7
cyclo-Propyl		I	3-Trifluormethylcyclohexyl	ıylcyclohexyl	-N=C(CH3) 2			n	>
cvclo-Propyl		I	Allyl		-N=C(CH3)			S	0
cyclo-Propyl		I	1-Buten-3-yl		-N=C(CH3)			S	0
cvclo-Propyl		I	Crotyl		-N=C(CH3)			S	0
cyclo-Propyl		I	Propargyl		-N=C(CH3)			S	0
Allyl		I	1-Butin-3-yl		-N=C(CH3)			S	0
Allvl		Ξ	3-Methyl-1-butin-3-yl	tin-3-yl	-N=C (CH3)			S	0
A11v1		I	2-Pentin-4-yl		-N=C(CH3)			S	0
Allyl		I	Benzyl		-N=C(CH3)	-		S	0
Allyl		I	2-Phenylethyl		-N=C(CH3)			S	0
Allvi		I	2-Methylthioethy	thy1	-N=C(CH3)			S	0
Ethinv1		I	2-Chlorethyl		-N=C(CH3)			S	0
Ethinyl		I	2-Methoxyethyl	_	-N=C(CH3)			S	0
Ethinyl		I	2-(n,N-Dimethylamino)ethyl	ylamino)ethyl	-N=C(CH3)			S	0
Ethinyl		I	Phenyl		-N=C(CH ₃)	•		S	0
Ethinyl		I	2-CH ₃ -Phenyl		-N=C(CH3)	~		S	0
Ethinyl		I	4-CH3-Phenyl		-N=C(CH ₃)	~		s	0
Methoxy		I	2, 4-(CH ₃ , CH ₃)-Phenyl	-Phenyl	-N=C(CH3)	~		S	0
Methoxy		I	2, 3, 5- (CH ₃ , CH ₃ , CH ₃) -Pheny l	3, CH3)-Pheny 1	-N=C(CH3)	~		S	0
Methoxy		=	3-CF ₃ -Phenyl		-N=C(CH3)	~		S	0
Methoxy		I	3-F-Phenyl		-N=C(CH3)	~		S	0
Methoxy		I	2-C1-Phenyl		-N=C(CH3)	2		S	0
Methoxy		I	4-Cl-Phenyl	-	-N=C(CH3)			s	0
4-C1-Phenoxy		Ξ	2, 4-(F, F)-Pheny l	nyl	-N=C(CH3)	2		s	0
4-C1-Phenoxy		Ŧ	2, 3, 5-(cl, cl, cl)-Phenyl	Cl)-Phenyl	-N=C(CH3)2	~		S	0

50 55	50	4 5	40	35	30	25	20	15	10	•	5
12			R3	R4			RS			×	>
4-C1-Phenoxy			I	2-CN-Pheny]			-N=C(CH3),			v	- c
4-Cl-Phenoxy			Ŧ	2-0CH ₃ -Pheny1	inyl					S	• •
4-C1-Phenoxy			Ŧ	2, 3-(OCH ₃ ,	2, 3-(OCH ₃ , OCH ₃)-Phenyl		-N=C(CH3)2			S	0
4-C1-Phenoxy			I	3, 4, 5- (осн	3, 4, 5-(OCH3, OCH3, OCH3)-Phenyl	I S	-N=C(CH3)2			s	0
Phenylthio			I	3-OCF ₃ -Phenyl	lyı		-N=C (CH3) 2			S	0
Phenylthio			I	4-OCF 2CHF 2-Pheny	-Pheny1		-N=C (CH3) 2			S	0
Phenylthio			I	2-SCH ₃ -Phenyl	ınyı		-N=C (CH3) 2			S	0
Phenylthio			I	2, 4- (SCH ₃ ,	2, 4-(SCH ₃ , SCH ₃)-Phenyl		-N=C (CH3) 2			S	0
Phenylthio			I	2-SCF ₃ -Pheny	nyl		-N=C (CH3) 2			S	0
Phenylthio			I	4-NO ₂ -Phenyl	ıyı		-N=C (CH3) 2			S	0
2, 4-(C1, C1)-	Phenyl		I	2, 4- (NO ₂ , N	2, 4-(NO ₂ , NO ₂)-Phenyl		-N=C (CH3) 2			S	0
2, 4-(C1, C1)-	Phenyl		I	2-CHO-Phenyl	ıyı		-N=C (CH3) 2			တ	0
2, 4-(c1, c1)-	Phenyl		I	3-COCH ₃ -Pheny	enyl		-N=C (CH ₃) ₂			S	0
2, 4-(c1, c1)-	Phenyl		Ξ	3-COCF ₃ -Pheny	enyl		-N=C (CH3) 2	•		S	0
2, 4-(C1, C1)-	Phenyl		I	1-Naphthyl			-N=C (CH3) 2			S	0
2,4-(01,01)-	Phenyl		I	2-Naphthyl			-N=C (CH ₃) ₂			S	0
2-Thienyl			.	Piperidinyl			-N=C (CH3) 2			S	0
2-Thienyl			I	3-Tetrahydrofuranyl	Irofuranyl		-N=C (CH ₃) ₂			S	0
2-Thienyl			I	4-Tetrahydropyranyl	ropyranyl		-N=C (CH3) 2			s	0
2-Thienyl			I	2-Thiazolyl	-		-N=C (CH ₃) ₂			S	0
2-Thienyl			I	5-CH ₃ -2-Thiazoly	iazolyl		-N=C (CH3) 2			S	0
2-Thienyl			I	4-CH3-5-CO	4-CH ₃ -5-C00H-2-Thiazolyl		-N=C(CH ₃) ₂			s	0
3-Pyridyl			I	Methyl			-N=C (CH3) 2			S	0
3-Pyridyl			I	Ethyl			-N=C (CH ₃) ₂			S	0
3-Pyridyl			I	n-Propyl			-N=C (CH3) 2			S	0

5	> -	s s	S	S	s s	S	S	S	S	S	S	S	S	S	S	s. s	S	S	S	S	S	S	S	S	S	s s
16		ıtyl		ıyı	ieny l	2, 4-(c1, c1)-Phenyl	=			l y l		ıtyl				y)		ıtyl		l y l	ıenyl	2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl	=			y l
25	RS	tertButyl	Pheny l	4-F-Pheny l	3-CF ₃ -Phenyl	2, 4-(C1,	2-Pyridyl	Methyl	Ethyl	iso-Propyl	Butyl	tertButyl	Pheny 1	Methy 1	Ethyl	iso-Propyl	Butyl	tertButyl	Pheny 1	4-F-Pheny l	3-CF ₃ -Phenyl	2, 4-(c1,	2-Pyridyl	Methyl	Ethyl	iso-Propyl
30		lyl	l y:	ly.	ly.	ıyı	ly.	ly.	l y.	ıyı	l K:	l k:	lų:	l k:	l ų:	l k:	.y1	ıyı	l k:	lų	l y.	ıyı	ľų:	ıyı	ıyl	:y1
35	R 4	tertButyl	tertButy	tertButyl	tertButyl	tertButy	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButy]	tertButy	tertButy	tertButy	tertButy	tertButy]	tertButy	tertButy	tertButy	tertButy	tertButy	tertButy	tertButy	tertButy	tertButy	tertButy	tertButy
40	R3	I	I	I	I	I	I	I	I	I	x	Ŧ	I	I	I	I	Ŧ	I	I	I	I	I	I	I	I	I
45																								-		
50 55		cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	lo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	Allyl	Ally	-	Allyl	y1	Allyl	Methoxy	Methoxy	Methoxy	Methoxy	Methoxy	Methoxy	Methoxy	4-C1-Phenoxy	4-Cl-Phenoxy	4-C1-Phenoxy	4-C1-Phenoxy	4-CI-Phenoxy	4-Cl-Phenoxy

50 - 55		45	40	35	30	25	20	15	10	5	
R1			R3 F	R4			R5			*	>
			3	tort -Rutul			Antvl			U	_v.
2 6-(C1 C1)-P	tono1		: 1	tertButvl			tertButvl			S	S
2,4-(C1,C1)-p	henvl		: =	tertButvl			Phenyl			S	S
2,4-(C1,C1)-P	henyl		: =	tertButyl			4-F-Phenyl			S	S
2,4-(C1,C1)-Phenyl	henyl		I	tertButyl			3-CF ₃ -Phenyl			S	S
2,4-(c1,c1)-F	henyl		I	tertButyl			2, 4-(C1, C1)-Phenyl	henyl		s	S
2,4-(01,01)-6	Pheny 1		Ŧ	tertButyl			2-Pyridyl			S	s
2,4-(01,01)-6	Phenyl		I	tertButyl			Ethyl			S	S
2-Thienyl			I	tertButyl			iso-Propyl			S	S
2-Thienyl			I	tertButyl			Butyl			တ	S
2-Thienyl			I	tertButyl			tertButyl			S	S
3-Pyridyl			I	tertButyl			Phenyl			S	S
3-Pyridyl			, =	tertButyl			4-F-Phenyl			S	s
3-Pyridyl			I	tertButyl			3-CF ₃ -Phenyl			S	S
Methyl			x	cyclo-Propyl			2, 4-(C1, C1)-Phenyl	henyl		S	S
Methyl			I	cyclo-Propyl			2-Pyridyl			S	s
Methyl			I	cyclo-Propyl			Ethy1			ဟ	s
Methyl			I	cyclo-Propyl			iso-Propyl			S	S
Methyl			I	cyclo-Propyl			Butyl			S	s
Methyl			I	cyclo-Propyl			tertButyl			S	s
Methyl			I	cyclo-Propyl			Pheny1			S	S
iso-Propyl			I	cyclo-Propyl			4-F-Phenyl			S	s
iso-Proply			Ŧ	cyclo-Propyl			3-CF ₃ -Pheny l			S	S
iso-Propyl			I	cyclo-Propyl			2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl	henyl		S	s
iso-Propyl			I	cyclo-Propyl			2-Pyridyl			S	S

55	4 5	40	_. 35	30	25	20	15	10	5	
1 2		83	R4			RS		×	>	
										_
iso-Propyl		I	cyclo-Propyl		_	Methyl		S	V)	
iso-Propy		I	cyclo-Propyl			Ethyl		S	(C)	
iso-Propyl		I	cyclo-Propyl			iso-Propyl		S	()	
cyclo-Propyl		I	cyclo-Propyl			Butyl		S	v,	
cyclo-Propy	_	I	cyclo-Propyl			tertButyl		S	0,	
cyclo-Propyl	_	I	cyclo-Propyl			Phenyl		S	U)	
cyclo-Propyl	-	Ŧ	cyclo-Propyl			4-F-Phenyl		S	σ,	
cyclo-Propy	-	I	cyclo-Propyl			3-CF ₃ -Phenyl		S	V)	
cyclo-Propy	-	, =	cyclo-Propyl			2, 4-(cl, cl)-Phenyl	nyl	S	v,	
cyclo-Propyl	-	±	cyclo-Propyl			2-Pyridyl		S	u,	
Allyl		I	cyclo-Propyl			Methyl		S	U)	
Allyl		I	cyclo-Propyl			Ethyl		S	U)	
Allyl		I	cyclo-Propyl			iso-Propyl		S	U 1	
Allyl		Ŧ	cyclo-Propyl			Butyl		S	S	
Allyl		I	cyclo-Propyl			tertButyl		S	σ,	
Allyl		I	cyclo-Propyl			Pheny l		S	S	••
Methoxy		I	cyclo-Propyl			Methyl		S	S	••
Methoxy		I	cyclo-Propyl			Ethyl			S	"
Methoxy		I	cyclo-Propyl			iso-Propyl		S	υ,	
Methoxy		I	cyclo-Propyl			Butyl		S	S	۰,
Methoxy		I	cyclo-Propyl			tertButyl		S	S	
Methoxy		Ξ	cyclo-Propyl			Phenyl		S	S	
Methoxy		I	cyclo-Propyl			4-F-Phenyl		S		S
4-C1-Phenoxy	хх	I	cyclo-Propyl			3-CF ₃ -Phenyl		S		S
4-C1-Phenoxy	x	I	cyclo-Propyl			2, 4-(c1, c1)-Phenyl	ny l	S		S

55	50	45	40	35	30	25	20 -	15	10	5	
ī a			æ	4			RS			×	>
4-C1-Phenoxy	>		x	cyclo-Propyl			2-Pyridyl			S	ر س
4-Cl-Phenoxy	. >		=	cyclo-Propyl			Methyl			S	S
4-C1-Phenoxy	. >		I	cyclo-Propyl			Ethyl			S	s
4-C1-Phenoxy	, >,		=	cyclo-Propyl			iso-Propyl			တ	s
4-C1-Phenoxy	. >		I	cyclo-Propyl			Butyl			S	S
2, 4-(C1, C1)	-Phenyl		I	cyclo-Propyl			tertButyl			တ	S
2, 4-(C1, C1)-Phenyl	-Phenyl		Ŧ	cyclo-Propyl			Phenyl			ဟ	ဟ
2, 4-(C1, C1)	-Pheny 1		I	cyclo-Propyl		-	4-F-Phenyl			ဟ	S
2,4-(01,01)	-Pheny 1		I	cyclo-Propyl			3-CF ₃ -Phenyl			S	S.
2,4-(C1,C1)	-Pheny 1		Ŧ	cyclo-Propyl			2, 4-(C1, C1)-Phenyl	henyl		S	S
2, 4-(01,01)	-Pheny 1		Ŧ	cyclo-Propyl			2-Pyridyl			ဟ	S
2, 4-(C1, C1)-Phenyl	-Pheny 1		I	cyclo-Propyl			Ethyl			ဟ	S
2-Thienyl			Ŧ	cyclo-Propyl			iso-Propyl			တ	S
2-Thienyl			Ė	cyclo-Propyl			Butyl			S	S
2-Thienyl			I	cyclo-Propyl			tertButyl			S	S
3-Pyridyl			¥	cyclo-Propyl			Phenyl			S	တ
3-Pyridyl			I	cyclo-Propyl			4–F–Phenyl			S	S
3-Pyridyl			I	cyclo-Propyl			3-CF ₃ -Phenyl			ဟ	S
Ch1or			x	tertButyl			4-Hydroxy-2-butinyl	outinyl		0	0
Chlor	٠		I	tertButyl			N=C(C2H5)2			0	0
Chlor			I	tertButyl			N=C(cyclo-C ₃ H ₅)	15) 2		0	0
Chlor			I	tertButyl			2-Butanimino			0	0
Chlor			I	tertButyl			Cyclohexanimino	ino		0	0
Chlor			I	tertButyl			Cyclooctanimino	ino		0	0
Methyl			I	tertButyl			N=CH-C ₆ H ₅			0	0

	R3	R4		RS		×	>	
	3	10000		2-Furvl-methaniming	animino	0	-0	
Methy!	c 3	tertButyl		CH 2CH 2N (CH 3) 2	2	0	.0	
metny: Methul	: 3	tertButvl		CH2CH2N+(CH3)31]31_	0	0	
metny i	: I	tertButvl		CH ₂ CF ₃		0	0	
Methy!	Ξ.	tertButyl		CH ₂ CH ₂ Cl		0	0	
Methyl	.	tertButyl		CH ₂ CH ₂ CN		0	0	
so-Propvl	I	tertButyl		CH2CC13		0	0	
so-nroby]	I	tertButyl		CH2CH2Si (CH3)3) 3	0	0	
50 propy:	I	tertButyl		CH2CH20-N=C(CH3)2	CH ₃) ₂	0	0	
so-propyl	I	tertButyl		CH2PO(OC2H5)2	2	0	0	
So-propv]	I	tertButyl		сн(сн3)сн(осн3)	H3)2	0	0	
So-propy]	Ŧ	tertButyl		CH2-CON(C2H5)2	.) 2	0	0	
-propvl	I	tertButyl		Benzyl		0	0	
cvclo-Probvl	I	tertButyl		2, 4-(C1, C1)-Benzyl	Benzyl	0	0	
cyclo-Propvl	I	tertButyl		3-Pyridyl-methyl	thyl	0	0	
cyclo-Probyl	I	tertButyl		2-Thienyl-methyl	thyl	0		
cyclo-Propyl	I	tertButyl		2-Tetrahydro	2-Tetrahydrofuranyl-methyl	0	0	
cyclo-Propyl	Ξ	tertButyl		2-Furanyl-methyl	thyl	0	0	
cyclo-Propyl	I	tertButyl		2-Pyridyl-methyl	thyl	0	0	
cyclo-Propyl	I	tertButyl		Pheny1		0	0	
, (1)	I	tertButyl		4-F-Phenyl		0	0	
A1151	Ξ	tertButyl		4-Trifluormethylphenyl	thylphenyl	0	0	
A113.	I	tertButyl		2-N0 ₂ -4-F-Pheny l	ieny l	0	0	
	Ξ	tertButyl		3, 5-(CF ₃ , CF ₃)-Phenyl)-Phenyl	0		
ואווש	x	tertButyl		4-OCH ₃ -Phenyl		0	0	

55	50	45	40	35	30	25	20	15	10	5	
7			<u>~</u>	· •			ن د د			×	>
-											_
Phenylthio			I	tertButyl			4-F-Phenylethyl	ıyı		0	. 0
Pheny ithio			I	tertButyl			Phthalimido			0	0
Phenylthio			I	tertButyl			Tetrahydrophthalimido	thalimido		0	0
Phenylthio			I	tertButyl			Maleinimido			0	0
Phenylthio			I	tert,-Butyl			Succinimido			0	0
2, 4-(C1, C1)-Pheny	-Phenyl		I	tertButyl			Piperidino			0	0
2, 4-(C1, C1)	-Phenyl		I	tertButyl			Li ⁺			0	0
2,4-(C1,C1)	-Phenyl		I	tertButyl			Na+			0	0
2, 4-(c1, c1)	-Phenyl		I	tertButyl			ţ			0	0
2,4-(C1,C1)-Phenyl	-Phenyl		I	tertButyl			NH¢+			0	0
2, 4-(C1, C1)	-Phenyl		Ŧ	tertButyl			Diisopropylammonium	mnon i um		0	0
2, 4-(C1, C1)	-Phenyl		I	tertButyl		•	2-Hydroxyethyl-ammonium	/l-ammonium		0	0
2-Thienyl			I	tertButyl			Allyl			0	0
2-Thienyl			I	tertButyl			Methallyl			0	0
2-Thienyl			Ŧ	tertButyl			2-Chlorallyl			0	0
2-Thienyl			I	tertButyl			Propargy1			0	0
2-Thienyl			I	tertButyl	-		3-Iodpropargyl	۱,		0	0
Chlor			I	cyclo-Propyl			4-Hydroxy-2-butinyl	butinyl		0	0
Chlor			I	cyclo-Propyl			N=C(C ₂ H ₅) ₂			0	0
Chlor			I	cyclo-Propyl			N=C(cyclo-C3H5)	H5)2		0	0
Chlor			I	cyclo-Propyl			2-Butanimino			0	0
Chlor			I	cyclo-Propyl			Cyclohexanimino	ino		0	0
Chlor			I	cyclo-Propyl			Cyclooctanimino	ino		0	0
Methyl			I	cyclo-Propyl			N=CH-C ₆ H ₅			0	0
Methyl			I	cyclo-Propyl			2-Furyl-methanimino	animino		0	0

50 55	4 5	40	35	30	25	20	15	10	5		
R1		R3	R4			R5			×	>	1
Methyl		I	cyclo-Propyl			CH2CH2N(CH3)2) 2		0	٥	
Methyl		I	cyclo-Propyl			CH ₂ CH ₂ N ⁺ (CH ₃) ₃ I	3) 31_		0	0	
Methy 1		I	cyclo-Propyl			CH ₂ CF ₃			0	0	
Methy!		I	cyclo-Propyl			CH ₂ CH ₂ C1			0	0	
Methyl		I	cyclo-Propyl			CH ₂ CH ₂ CN			0	0	
iso-Propyl		I	cyclo-Propyl			CH ₂ CC1 ₃			0	0	
iso-Propyl		I	cyclo-Propyl			CH ₂ CH ₂ S i (CH ₃) ₃	3)3		0	0	
iso-Propyl		x	cyclo-Propyl			CH2CH20-N=C(CH3)2	(CH ₃) ₂		0	0	
iso-Propyl		Ŧ	cyclo-Propyl			CH2PO(OC2H5)2)2		0	0	
iso-Propyl		=	cyclo-Propyl			сн(сн3)сн(осн3)	CH3) 2		0	0	
iso-Propyl		I	cyclo-Propyl			CH2-CON(C2H5)2	15)2		0	0	
iso-Propyl		Ŧ	cyclo-Propyl			Benzyl			0	0	
cyclo-Propyl		I	cyclo-Propyl			2, 4-(C1, C1)-Benzyl	-Benzyl		0	0	
cyclo-Propyl		I	cyclo-Propyl			3-Pyridyl-methyl	ethyl		0	0	
cyclo-Propyl		I	cyclo-Propyl			2-Thienyl-methyl	ethyl		0	0	
cyclo-Propyl		Ξ	cyclo-Propyl			2-Tetrahydr	2-Tetrahydrofuranyl-methyl	thyl	0	0	
cyclo-Propyl		Ι	cyclo-Propyl			2-Furanyl-methyl	ethy1		0	0	
cyclo-Propyl		I	cyclo-Propyl			2-Pyridyl-methyl	lethy l		0	0	
cyclo-Propyl		I	cyclo-Propyl			Phenyl			0	0	
Allyl		I	cyclo-Propyl			4-F-Phenyl			0	0	
Allyl		I	cyclo-Propyl			4-Trifluorn	4-Trifluormethylphenyl		0	0	
Allyl		I	cyclo-Propyl			2-N0 ₂ -4-F-Pheny	henyl		0	0	
Allyl		Ξ	cyclo-Propyl			3, 5-(CF 3, CF 3)-Phenyl	3)-Phenyl		0	0	
Allyl		I	cyclo-Propyl			4-0CH ₃ -Pheny	ly.		0	0	
Allyl		I	cyclo-Propyl			4-OCF 3-Pheny l	ıy.l		0	0	

5	> ×	— c		0	0 0	0 0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	thy1 0 0	-methyl 0 0	0	0 0	0 0	0 0	
5 0	R5		4-NHCOCH 3-Pheny I	2-Tetrahydropyranyl	2-Tetrahydropyranyl	1-Benzotriazolyl	Methyl	Ethyl	n-Propyl	iso-Propyl	n-Butyl	iso-Butyl	sekButyl	tertButyl	cyclo-Hexyl	Cyclopropylmethyl	Ethoxymethyl	2-Methoxy-ethoxy-methyl	Benzyloxymethyl	(4-Brombenzoxyl)-methyl	(4-Methoxybenzoxyl)-methyl	Phthalimidomethyl	Methylthiomethyl	2-Thiomethyl-ethyl	сн(сен5)соосн3	
25														-												
30 35	R4		cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	
40	R3		I	I	I	I	Ŧ	Ŧ	I	I	I	Ξ	I	I	I	÷	Ξ	I	I	I	Ξ	I	I	Ŧ	I	
45											-														•	
50			Allyl	Ethinvl	Ethinyl	Ethiny]	Ethiny]	Ethinyl	Ethinyl	Ethinyl	Methoxy	Methoxy	Methoxy	Methoxy	Methoxy	Methoxy	Methoxy	4-C1-Phenoxy	4-C1-Phenoxy	C1-Phenoxy	C1-Phenoxy	4-C1-Phenoxy	C1-Phenoxy	C1-Phenoxy	Phenvithio	

55	50	45	40	35	30	25	20	15	10	·	5	
R1			R3	R4			R 5			*	>	
Phenylthio			I	cyclo-Propyl	_		Phthalimido			0	o	
Phenylthio			I	cyclo-Propy	1		Tetrahydrophthalimido	hthalimido		0	0	
Phenylthio			Ŧ	cyclo-Propy			Maleinimido			0	0	
Phenylthio			x	cyclo-Propy	1		Succinimido			0	0	
2, 4-(C1, C1)-Pheny	-Pheny 1		±	cyclo-Propy	_		Piperidino			0	0	
2, 4-(C1, C1)-Pheny	-Pheny l		I	cyclo-Propy			Li+			0	0	
2, 4-(C1, C1)	-Pheny l		I	cyclo-Propy	_		Na+			0	0	
2, 4-(C1, C1)-Pheny	Phenyl		I	cyclo-Propy	ب		+			0	0	
2, 4-(C1, C1)-Pheny	-Phenyl		×	cyclo-Propy	÷.		NH¢+			0	0	
2, 4-(C1, C1)-Pheny	-Pheny l		I	cyclo-Propy	_		Diisopropylammonium	ammon i um		0	0	
2, 4-(C1, C1)-Pheny	-Phenyl		Ŧ	cyclo-Propy	_		2-Hydroxyet	2-Hydroxyethyl-ammonium	_	0	0	
2-Thienyl			Ŧ	cyclo-Propy			Allyl			0	0	
2-Thienyl			I	cyclo-Propy	_		Methallyl			0	0	
2-Thienyl			I	cyclo-Propy	-	-	2-Chlorally	_		0	0	
2-Thienyl			I	cyclo-Propy	-		Propargyl			0	0	
2-Thienyl			I	cyclo-Propy	=		3-Iodpropargyl	gyl		0	0	
×			I	tertButy			-N=C (CH ₃) ₂			0	0	
L			I	tertButy			-N=C (CH ₃) ₂			0	0	
CI			Ŧ	tertButy			-N=C (CH3) 2			0	0	
Methyl			×	tertButy			-N=C (CH3) 2			0	0	
Ethyl			Ξ	tertButy	_		-N=C (CH3) 2			0	0	
n-Propyl	•		Ŧ	tertButy	_		-N=C (CH3) 2			0	0	
iso-Propyl			Ŧ	tertButy			-N=C (CH3) 2			0	0	
n-Butyl			Ŧ	tertButyl			-N=C(CH3)2			0	0	
iso-Butyl			I	tertButy			-N=C (CH3) 2			0	0	

R1 R3 R4 R5 sek-Buty1 H tertButy1 -N=C(CH3)2 tertButy1 H tertButy1 -N=C(CH3)2 cyclo-Propy1 H tertButy1 -N=C(CH3)2 cyclo-Penty1 H tertButy1 -N=C(CH3)2 cyclo-Hepty1 H tertButy1 -N=C(CH3)2 cyclo-Hepty1 H tertButy1 -N=C(CH3)2 cyclo-Hepty1 H tertButy1 -N=C(CH3)2 Trifuormethy1 H tertButy1 -N=C(CH3)2 Trifuormethy1 H tertButy1 -N=C(CH3)2 Rentafluorethy1 H tertButy1 -N=C(CH3)2 Iso-Propoxy H tertButy1 -N=C(CH3)2 Methy1methoxyethy1 H tertButy1 -N=C(CH3)2 I-Methy1methoxyethy1 H tertButy1 -N=C(CH3)2 Viny1 H tertButy1 -N=C(CH3)2 Winy2 H tertButy1 -N=C(CH3)2 Croty1 H tert	55	4 5 5 0	40	35	30	25	20	15	10	5	
H tertButyl											
H tertButy]	R1		R3	R4		~	5			×	_
H tertButyl Nyl H tertButyl H tertButyl Oxymethyl H tertButyl		•				•		-			
H tertButy] Ny] H tertButy] Ny] H tertButy] H tertButy] Ny] H tertButy]	sekButyl		I	tertButyl		•	N=C (CH3) 2			0	0
H tertButy] I H tertButy] I H tertButy] Oxymethy] H tertButy]	tertButyl		I	tertButyl		1	N=C (CH3) 2			0	0
H tertButy] Oxymethy] H tertButy]	cyclo-Propy	-	I	tertButyl		1	N=C (CH3) 2			0	0
h tertButyl l h tertButyl	cyclo-Butyl		I	tertButyl		1	N=C (CH3) 2			0	0
H tertButyl	cyclo-Penty		I	tertButyl		1	N=C (CH3) 2			0	0
H tertButyl	cyclo-Hexyl		I	tertButyl			N=C (CH3) 2			0	0
opropy] H tertButy] methy] H tertButy] H tertButy] H tertButy] H tertButy] I H tertButy]	cyclo-Hepty	_	I	tertButyl		1	N=C (CH3) 2			0	0
cyclopropyl H tertButyl Thuormethyl H tertButyl Torethyl H tertButyl Toxy	cyclo-Octyl		Ξ	tertButyl		•	N=C (CH3) 2			0	0
<pre>methy! methy! fluormethy! fluormethy! fluormethy! fluorethy! fluorethy! fluorethy! floorethy! floorethy!</pre>	1-Methylcyc	lopropyl	Œ	tertButyl		1	N=C (CH3) 2			0	0
<pre>fluormethy! Jorethy! Jorethy! H tertButy! M tertButy! Imethoxymethy! H tertButy! H tertButy!</pre>	Trifluormet	thy l	I	tertButyl		•	N=C (CH3) 2			0	0
locathyl boxy H tertButyl methyl H tertButyl Imethoxymethyl H tertButyl	Chlordi fluo	rmethyl	I	tertButyl			N=C (CH3) 2			0	0
h tertButyl methyl Imethoxymethyl Imethoxyethyl Imethoxyel Imethoxyethyl	Pentafluore	thyl	I	tertButyl		•	N=C (CH3) 2			0	0
<pre>nethyl nethoxymethyl Imethoxyethyl Imethoxyethyl Imethoxyethyl Imethoxyethyl H tertButyl H tertButyl</pre>	iso-Propoxy	_	I	tertButyl		1	N=C (CH3) 2			0	0
<pre>Imethoxymethy]</pre>	Methoxymeth	lyl	I	tertButyl		•	N=C (CH3) 2			0	0
<pre>Imethoxyethy! Imethoxyethy! th tertButy! H tertButy!</pre>	1-Methylmet	:hoxymethyl	I	tertButyl			N=C (CH3)2			0	0
ethyl H tertButyl	1-Methylmet	hoxyethyl	I	tertButyl		•	N=C(CH3)2			ο.	0
H tertButyl	Ethoxymethy		I	tertButyl		•	N=C (CH3) 2			0	0
H tertButyl	Vinyl		I	tertButyl		•	N=C (CH3) 2			0	0
H tertButyl H tertButyl H tertButyl H tertButyl thinyl H tertButyl H tertButyl	Allyl		Ξ	tertButyl		•	N=C (CH3) 2			0	0
H tertButyl H tertButyl yl H tertButyl thinyl H tertButyl H tertButyl	Methallyl		I	tertButyl		1	N=C (CH3) 2			0	0
H tertButyl yl H tertButyl thinyl H tertButyl	Crotyl		I	tertButyl		•	N=C (CH3) 2			0	0
yl H tertButyl thinyl H tertButyl H tertButyl	Ethinyl		I	tertButyl		ł	N=C (CH3) 2			0	0
inyl H tertButyl H tertButyl	Propargyl	-	I	tertButyl		ı	N=C (CH3) 2			0	0
H tertButyl	Phenylethin	ly1	Ξ	tertButyl			N=C (CH3) 2			•	0
•	Methoxy		I	tertButyl		•	N=C(CH3)2			0	0

5 5	50	45	.40		35	30	25	20	15	10	5	
8 1			R 3	R4				R5			×	>
											c	ć
Ethoxy			I	tertButy	Butyl			-N=C(CH3)2			,	<u>5</u> (
Trifluormethoxv	nethoxv		I	tertButy	Butyl			-N=C (CH3) 2			0	0
Mothy 1thio	jo		3	tertButy	Butyl			-N=C (CH3) 2			0	0
To i f 1 norn	meting tento Trifluormethulthio		==	tertButy	Butyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0
10011111			=	tertButy	Butyl			-N=C (CH3) 2			0	0
k-Cl-bhenovy	2		: =	tertButy	Butyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0
4-C1-File	4-CI-Filenday		.	tertButy	Butyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0
7,4-101,	CIJ-ruemovj		: 3	tertButv	Butvl			-N=C (CH ₃) ₂			0	0
4-Cr3-ruenoxy	enoxy		: 3	tort -Butv	Butvl			-N=C (CH ₃) ,			0	0
Pheny !			E =	tont _Buty	יייים.			-N=C (CH3) 2			0	0
2-F-Phenylthlo	ylthlo		E :	101	Butul			-N=C(CH3)			0	0
3-F-Phenyl	lyl		I	tert.—buty	- aucy 1			M-C (CH2) 2			c	c
2, 4-(F, F	:)-Phenyl		I	tertButy	-Butyl			-N=C(cm3)2			•	, ,
2-C1-Phe	2-c1-Phenyl		I	tertButy	-Butyl			-N=C(CH3)2			-	o (
3-C1-Phenvl	, u,		I	tertButy	-Butyl			-N=C (CH3) 2			0	0
2 4-(Cl	2 4-(c1 c1)-Phenvl		I	tertButy	-Butyl			-N=C (CH3) 2			0	0
2-CHDhenv			I	tertButy	-Butyl			-N=C (CH3) 2			0	0
2 CII OF	ich) i		=	tertButv	-Butyl			-N=C (CH3) 2			0	0
J-Ch3-rhenyi	ieny i		: =	tert.	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0
4-CH3-Filenyi	neny i ou l'obeaul		: 2	tort	tertButvl			-N=C (CH ₃) ₂			0	0
Z, 4-(CH:	Z, 4-(CH3, CH3)-rilelly 1	1	: 1	tert	tert -Butvl			-N=C (CH ₃) ₂			0	0
7, 4, 0-((Z, 4, 6-(CH3, CH3, CH3)-riieiiy i	rrieny i	=	; .				- (CHJ) J=N-			0	0
2-CF ₃ -Phenyl	henyl		I	tert.	tertButyi			7 (5113) 7			• •	
2-0CH ₁ -Phenyl	Pheny l		I	tert.	tertButyl			-N=C(CH3)2	•		> 0	.
2 4- (00)	2 4-(OCH ₁ , OCH ₁)-Phenyl	ıyı	I	tert.	tertButyl			-N=C(CH3)2			o	5 (
4-OCF 1-Phenvl	Phenyl	· ·	I	tert.	tertButyl			-N=C (CH3) 2			o)
A-SCH3-Phenvl	Phenyl		I	tert.	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	O
S 11.70 - \$,							

55	50	45	40	35	30	25	20	16	10	5	
			•				1				
R1			R3	R4			R5			×	>
			=	4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4			1 no) 5 no			•	-6
3-20r 3-rne	ı Âu		=	יבו רי-םחואו			-M-1013/2			>	>
2, 4-(NO ₂ , NO ₂)-Pheny l	0 ₂)-Pheny1		I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0
4-N0 ₂ -Phen	yl		I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0
2-Thienyl			I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0
3-Thienyl			I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0
2-Furanyl			I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0
3-Furanyl			I	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0
2-Tetrahydrofuranyl	rofuranyl		×	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0
3-Tetrahyd	rofuranyl		, =	tertButyl			-N=C (CH ₃) ₂			0	0
· 2-Pyridyl			I	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0
3-Pyridyl			I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0
4-Pyridyl	٠		I	tertButyl			-N=C(CH3)2			0	0
2-Tetrahydropyrany	ropyranyl		I	tertButyl			-N=C (CH ₃) ₂			0	0
3-Tetrahydropyrany	ropyranyl		I	tertButyl			-N=C (CH ₃) ₂			0	0
4-Tetrahydropyrany	ropyranyl		I	tertButyl			-N=C (CH ₃) ₂			0	•
I			I	cyclo-Propyl			-N=C (CH ₃) ₂			0	0
Ŀ	٠		I	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0
15			I	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0
Methyl			I	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0
Ethyl			I	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0
n-Propyl			I	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0
iso-Propyl			I	cyclo-Propyl			$-N=C(CH_3)_2$			0	0
n-Butyl			I	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0
iso-Butyl			I	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0
sekButyl			I	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0

Butyl Propyl Butyl Butyl Heptyl Heptyl Octyl Jorgethyl Hifluormethyl Kymethyl Hylmethoxymethyl Hylmethoxyethyl	4				
rtButyl clo-Propyl clo-Butyl clo-Butyl clo-Hexyl clo-Hexyl clo-Heptyl clo-Heptyl hiclo-Octyl Methylcyclopropyl hiordifluormethyl so-Propoxy sthoxymethyl H H H H H H H H H H H H H H H H H H H		R5		· ×	> -
H H H H H H H H H H H H H H H H H H H					
H H H H H H H H H H H H H H H H H H H	cyclo-Propyl	-N=C (CH ₃) 2	•	9	~
H II H Il H Ilopropyl Sthyl Sthyl H Sthyl H H H H H H H H H H H H H	cyclo-Propyl	-N=C(CH3)2		0	0
II H H II H II H II H III H II	cyclo-Propyl	-N=C (CH3) 2		0	0
H H Opropyl H methyl H h h h h h h h h h h h h h h h h l h	cyclo-Propyl	-N=C (CH3) 2		0	0
opropyl H methyl H inyl H inyl H noxymethyl H noxyethyl H noxyethyl H	cyclo-Propyl	-N=C (CH ₃) ₂		0	0
opropyl H iyl H :hyl H :hyl H noxymethyl H noxyethyl H H	cyclo-Propyl	-N=C(CH ₃) ₂		0	0
1	cyclo-Propyl	-N=C(CH ₃) ₂		0	0
14. T T T T T T T T T T T T T T T T T T T	cyclo-Propyl	-N=C(CH ₃) ₂		0	0
	cyclo-Propyl	-N=C (CH ₃) ₂		0	0
н н н н н н	cyclo-Propyl	-N=C (CH3) 2		0	0
H H H H H H	cyclo-Propyl	-N=C (CH3) 2		•	0
xymethyl H.xyethyl H	cyclo-Propyl	-N=C(CH ₃) ₂		0	0
xymethyl H. xyethyl H	cyclo-Propyl	-N=C (CH3) 2		•	0
oxyethyl H H	cyclo-Propyl	-N=C (CH3) 2	_	0	0
II	cyclo-Propyl	-N=C (CH3) 2		•	0
3	cyclo-Propyl	-N=C (CH ₃) ₂		0	0
	cyclo-Propyl	-N=C (CH3) 2		0	0
	cyclo-Propyl	-N=C (CH ₃) ₂		0	0
H	cyclo-Propyl	-N=C (CH3) 2		0	0
=	cyclo-Propyl	-N=C (CH3) 2		0	0
I	cyclo-Propyl	-N=C (CH3) 2		0	0
H .	cyclo-Propyl	-N=C (CH3) 2		0	0
liny1 H	cyclo-Propyl	-N=C (CH ₃) ₂		0	0
I	cyclo-Propyl	-N=C (CH3) 2		0	0
I	cyclo-Propyl	-N=C (CH ₃) ₂		0	0

55	50	45	40		35	30	25	20	15	10	5	
7			~	4			•	ຜ			>=	>
R1			2	K 4								
Trifluormethoxy	ethoxy		I	cyclo-Propy	ropyl		•	-N=C (CH3) 2			0	~0
Methylthio	,		I	cyclo-Propy	ropyl		•	-N=C(CH ₃) ₂			0	0
Trifluorm	Trifluormethylthio		I	cyclo-Propy	ropyl		1	-N=C (CH3) 2			0	0
Phenoxy	•		I	cyclo-Propy	ropyl		•	-N=C(CH ₃) ₂			0	0
4-C1-Phen	oxy		I	cyclo-Propy	ropyl		•	-N=C (CH3) 2			0	0
2, 4-(C1, C	1)-Phenoxy		I	cyclo-Propy	ropyl		•	-N=C(CH ₃) ₂			0	0
4-CF 3-Phe	noxy		I	cyclo-Propy	ropyl		•	-N=C(CH ₃) ₂			0	0
Phenyl	Phenyl		I	cyclo-Propy	ropyl		•	-N=C(CH3)2			0	0
2-F-Pheny	lthio		=	cyclo-Propy	ropyl		•	-N=C(CH ₃) ₂			0	0
3-F-Phenyl	_		I	cyclo-Propy	ropyl		•	-N=C(CH ₃) ₂			0	0
2, 4-(F,F)	-Pheny l		Ŧ	cyclo-Propy	ropyl		•	-N=C (CH3) 2			0	0
2-C1-Phenyl	y l		I	cyclo-Propy	ropyl		•	-N=C (CH3) 2			0	0
3-C1-Phen	3-c1-Phenyl		¥	cyclo-Propy	Propyl		•	-N=C(CH ₃) ₂			0	0
2, 4-(C1, C	1)-Phenyl		I	cyclo-Propyl	propyl		•	-N=C (CH3) 2			0	0
2-CH ₃ -Phe	inyl		Ŧ	cyclo-Propyl	Propyl		•	-N=C(CH ₃) ₂			0	0
3-CH ₃ -Phenyl	inyl		I	cyclo-Propy	Propyl		•	-N=C(CH ₃) ₂			0	0
4-CH3-Phe	iny 1		I	cyclo-Propy	Propyl		•	-N=C (CH3) 2			0	0
2, 4-(CH ₃ ,	CH ₃)-Pheny1		Ŧ	cyclo-Propy	Propyl		•	-N=C (CH3) 2			0	0
2, 4, 6- (CH	13, CH3, CH3) —	Phenyl	Ŧ	cyclo-Propy	Propyl		•	N=C (CH ₃) ₂			0	0
2-CF3-Phe	2-CF ₃ -Phenyl		I	cyclo-Propy	Propyl		•	-N=C (CH3) 2			0	0
2-0CH ₃ -Phenyl	enyl		x	cyclo-Propy	Propy1		•	-N=C (CH ₃) ₂			0	0
2, 4- (OCH ₃	2, 4-(OCH ₃ , OCH ₃)-Phenyl	yl	Ξ	cyclo-Propy	Propyl		•	-N=C (CH3) 2			0	0
4-0CF ₃ -Phenyl	ieny l		I	cyclo-Propy	Propyl		•	-N=C (CH ₃) ₂			0	0
4-SCH ₃ -Pheny ¹	neny 1		×	cyclo-Propy	Propyl		-	-N=C (CH3) 2			0	0
3-SCF ₃ -Phenyl	nenyl		I	cyclo-Propyl	Propyl		-	-N=C (CH ₃) ₂			0	0

55	50	45	40		35	30	25	20	15	10	5	
R1			R.3	R4			RS	S.			×	_
				John	[אפל		ī	-N=C(CH3)3			0	Õ
2, 4-(NO ₂ , NO ₂) "Fileliy I) Frieny i		: I	cyclo-Propy	l fdc		7	-N=C(CH ₃) ₂			0	- o
2-Thieny			: =	cvclo-Propy	opyl		7	-N=C(CH ₃) ₂			0	0
3-Thienyl			=	cyclo-Propy	opy 1		ī	-N=C (CH ₃) ₂			0	0
2-Furanvl			I	cyclo-Propy	opyl		ī	-N=C (CH3) 2			0	0
3-Furanyl			I	cyclo-Propy	opyl		ī	-N=C (CH3) 2			0	0
2-Tetrahydropfuranyl	opfurany!		I	cyclo-Propyl	opyl		f	-N=C (CH3) 2			0	Ö
3-Tetrahydrofuranyl	ofuranyl		I	cyclo-Propy	opyl		,	-N=C (CH3) 2			0	0
2-Pyridyl	•		I	cyclo-Propy	opyl		1	-N=C (CH3) 2			0	0
3-Pyridyl			I	cyclo-Propy	opyl		I	-N=C (CH3) 2			0	0
4-Pvridvl			Ŧ	cyclo-Propy]	opyl		1	-N=C (CH3) 2			0	0
2-Tetrahydropyrany	opyranyl		I	cyclo-Propy	opyl		Ĭ	-N=C (CH3) 2			0	0
3-Tetrahydropyranyl	opyranyl		I	cyclo-Propy	opyl		•	-N=C (CH3) 2			0	0
4-Tetrahydropyranyl	opyranyl		I	cyclo-Propy	opyl		1	-N=C (CH3) 2			0	0
Chlor	• •		I	Methyl			=	_			0	0
Chlor			I	Ethyl			=	-			0	0
Chlor			I	n-Propyl			-				0	0
Chlor			I	iso-Propy	ly.		=	~			0	0
Chlor			Ŧ	n-Butyl			=	_			0	0
Chlor			I	iso-Buty]	-		-	-			0	0
Methy]			I	sekButy	l k:		-	-			0	
Methyl			I	n-Pentyl			-	T			0	0
Methy]			I	2-Pentyl			-	~			0	0
Methyl			I	3-Pentyl			_	-			0	0
Methyl			I	n-Hexyl							0	0

50 65	45	40	35		30	25	20	15	10	•	5
7		0	40			٥	ហ្វ			>	>
74		-				=					-
Methy1		I	2-Hexyl			=				0	-0
iso-Propyl		Ŧ	3-Hexyl			I				0	0
iso-Propyl		Ŧ	2-Methyl-2-pentyl	2-pentyl		I	_			0	0
iso-Propyl		I	cyclo-Propylmethyl	pylmethyl		I				0	0
iso-Propyl		I	cyclo-Butyl	yl		Ξ				0	0
iso-Propyl		I	cyclo-Pentyl	tyl		I				0	0
iso-Propyl		I	cyclo-Hexyl	yl		I	-			0	0
cyclo-Propyl		I	1-Methylcyclohexy	yclohexyl		I				0	0
cyclo-Propyl		I	3-Trifluo	3-Trifluormethylcyclohexyl	clohexyl	I				0	0
cyclo-Propyl		I	Allyl			I				0	0
cyclo-Propyl		I	1-Buten-3-y	-y1		I				0	0
cyclo-Propyl		I	Crotyl			I				0	0
cyclo-Propyl		I	Propargyl			I	_			0	0
Allyl		I	1-Butin-3-yl	l-y l		I	_			0	0
Allyl		I	3-Methyl-	3-Methyl-1-butin-3-y	l-y l	I	_			0	•
Allyl		I	2-Pentin-4-yl	4-y1		I	_			0	0
Allyl		I	Benzyl			I	_			0	0
Allyl		I	2-Phenylethyl	thyl		I	_			0	0
Allyl		I	2-Methylthioethyl	hioethyl		=	_			0	0
Ethinyl		I	2-Chlorethyl	hyl		I	_			0	0
Ethinyl		I	2-Methoxyethy	ethyl		I	_			0	0
Ethinyl		±	2-(N, N-Di	2-(N, N-Dimethylamino)ethyl	ino)ethyl	I	_			0	0
Ethinyl		Ŧ	Pheny 1			I	_			0	0
Ethinyl		I	2-CH ₃ -Phenyl	ınyl		I	_			0	0
Ethiny1		I	4-CH ₃ -Phenyl	inyl		I	_			0	0

55	50	45	40	35	30	25	20	15	10	5	
								-			
R1		R3	R4			R5	2			*	>
		3	7 1 6	(unoda-(uno cus)-9 c	-	3				-	_
Methoxy		= =		2,	enj: Hal-Phenvl	: I				. 0	. 0
Methoxy		: =	3-CF 3	3-CF 1-Pheny 1		I				0	0
Methoxy		=	3-F-Phenyl	henyl		I				0	0
Methoxy		I	2-C1-	2-C1-Phenyl		I				0	0
Methoxy		I	4-C1-	4-CI-Phenyl		I				0	0
4-C1-Phenoxy	ХУ	I	2, 4-(2, 4-(F, F)-Phenyl		I				0	0
4-C1-Phenoxy	×	±	2, 3, 5	2, 3, 5-(01,01,01)	-Pheny 1	I				•	0
. 4-C1-Pheno	χ	I,	2-CN-	2-CN-Phenyl		I				0	0
4-C1-Phenoxy	χλ	Ŧ	2-0CH	2-OCH ₃ -Phenyl		I				0	0
4-C1-Pheno	χχ	Ŧ	2, 3-(2, 3-(OCH3, OCH3)-Phenyl	Pheny1	I				0	0
4-C1-Phenoxy	, XX	I	3,4,5	- (осн 3, осн 3	3, 4, 5- (0CH ₃ , 0CH ₃ , 0CH ₃)-Pheny l	H				0	0
Phenylthio		I	3-0CF	3-OCF 3-Pheny l		I				0	0
Pheny 1 thio		Ξ.	4-0CF	4-OCF ₂ CHF ₂ -Phenyl	_	I				0	0
Phenylthio	-	I	2-SCH	2-SCH ₃ -Phenyl		Ξ				0	0
Phenylthio	_	I	2, 4-(2, 4- (SCH3, SCH3)-	-Pheny1	=				0	0
Phenylthio	-	I	2-SCF	2-SCF ₃ -Phenyl		I				0	0
Phenylthio		I	4-NO ₂	4-NO ₂ -Phenyl		=				0	0
2, 4-(C1, C1)-Phenyl	=	2, 4-(2, 4- (NO 2, NO 2)-Ph	-Phenyl	I				0	0
2, 4-(C1, C1	l)-Phenyl	=	2-CH0	2-CHO-Phenyl		I				0	0
2, 4-(c1, c1	l)-Phenyl	I	3-00	3-COCH ₃ -Phenyl		=				0	0
2, 4-(C1, C1	l)-Phenyl	Ξ	3-00	3-COCF 3-Phenyl		I				0	0
2, 4-(C1, C1	1)-Phenyl	.	1-Nap	1-Naphthyl		I				0	0
2,4-(C1,C1)-Phenyl	1)-Phenyl	I	2-Nap	2-Naphthyl		Ŧ				0	0
2-Thienyl		I	Piper	Piperidimo		=				0	0

50 55	40 45	35	30	25	20	15	10	5	
R1	R3	R4		R5		:		×	>-
									_
Z-Thlenyl	=	3-Tetrahydrofuranyl	ıy.l	Ŧ	-			0	o
2-Thienyl	Ŧ	4-Tetrahydrofurany	y.	I				0	0
2-Thienyl	I	2-Thiazolyl		I				0	0
2-Thienyl	Ŧ	5-CH3-2-Thiazolyl		I	,			0	0
2-Thienyl	Ŧ	4-CH3-5-COOH-2-Thiazolyl	iazolyl	I				0	0
3-Pyridyl	=	Methyl		I				0	0
3-Pyridyl	=	Ethyl		I				0	0
3-Pyridy1	I	n-Propyl		I				0	0
3-Pyridyl	Ŧ	iso-Propyl		I				0	0
3-Pyridyl	I	n-Butyl		I				0	0
3-Pyridyl	Ŧ	iso-Butyl		I				0	0
iso-Propyl	Methyl	sekButyl		I				0	0
iso-Propyl	Methyl	n-Pentyl		I				0	0
iso-Propyl	Methyl	2-Pentyl		I				0	0
iso-Pentyl	Methyl	3-Pentyl		I				0	0
iso-Propyl	Methyl	n-Hexyl		Ξ				0	0
iso-Propyl	Methyl	2-Hexyl		Ξ				0	0
iso-Propyl	Methyl	3-Hexy1		I				0	0
Chlor	Ŧ	Methyl		7	-N=C(CH3)2			0	0
Chlor	I	Ethyl		7	-N=C (CH3) 2			0	0
Chlor	I	n-Propyl		7	-N=C(CH ₃) ₂			0	0
Chlor	I	iso-Propyl		7	-N=C(CH ₃) ₂			0	0
Chlor	I	n-Butyl		7	-N=C(CH3)2			0	0
Chlor	I	iso-Butyl		2	-N=C(CH ₃) ₂			0	0
Methyl	I	sekButyl		7	-N=C (CH3) 2			0	0

55	45 50	40	35	25 30	20	15	10	5	
R1		R3	R4		R5			×	>
1		I	n-Pentul		-N=C (CH ₃),			0	-ō
Methyl		: I	2-Pentyl		-N=C (CH ₃) ₂			0	0
Methyl		I	3-Pentyl		-N=C(CH ₃) ₂			0	0
Methyl		I	n-Hexy1		-N=C (CH ₃) ₂			0	0
Methyl		I	2-Hexyl		-N=C (CH ₃) ₂			0	0
iso-Propy1		I	3-Hexyl		-N=C (CH ₃) ₂			0	0
1so-Propy1		I	2-Methyl-2-pentyl		-N=C (CH ₃) ₂			0	0
iso-Propyl		I	cyclo-Propylmethyl	1	-N=C (CH ₃) ₂			0	0
so-Propy		I	cyclo-Butyl		-N=C (CH ₃) ₂			0	0
iso-Propyl		I	cyclo-Pentyl		-N=C (CH ₃) ₂			0	0
iso-Propyl		I	cyclo-Hexyl		-N=C (CH ₃) ₂			0	0
cyclo-Propyl	_	I	1-Methylcyclohexyl	_	-N=C (CH ₃) ₂			0	0
cyclo-Propyl	_	I	3-Trifluormethylcyclohexyl	yclohexyl	-N=C(CH3)2			0	0
cyclo-Propyl	_	I	Allyl		-N=C (CH3) 2			0	o .
cyclo-Propyl		Ξ	1-Buten-3-yl		-N=C (CH3) 2			0	0
cyclo-Propy		I	Crotyl		-N=C (CH3) 2			0	0
cyclo-Propyl	-	I	Propargyl		-N=C (CH3) 2			0	0
Allyl		I	1-Butin-3-yl		-N=C (CH ₃) ₂			0	0
Allyl		I	3-Methyl-1-butin-3-y	-3-y1	-N=C(CH ₃) ₂			0	0
Allyl		I	2-Pentin-4-yl		-N=C (CH ₃) ₂			0	0
Allyl		I	Benzy1		-N=C (CH3) 2			0	0
Allyl		I	2-Phenylethyl		-N=C (CH3) 2			0	0
Allyl		Ξ	2-Methylthioethyl		-N=C (CH3) 2			0	0
Ethinyl		I	2-Chlorethyl		-N=C(CH ₃) ₂			0	0
Ethinyl		I	2-Methoxyethyl		-N=C(CH3)2			0	0

Ethinyl H 2-(N,N-Dimethylamino)-ethyl -N-C(CH3) Ethinyl H 2-(N,N-Dimethylamino)-ethyl -N-C(CH3) Ethinyl H 2-CH3-Phenyl -N-C(CH3) Ethinyl H 2-CH3-Phenyl -N-C(CH3) Methoxy H 2,4-(CH3,CH3)-Phenyl -N-C(CH3) Methoxy H 2,3,5-(CH3,CH3)-Phenyl -N-C(CH3) Methoxy H 2,4-(F,F)-Phenyl -N-C(CH3) A-CI-Phenoxy H 2,4-(F,F)-Phenyl -N-C(CH3) 4-CI-Phenoxy H 2,4-(F,F)-Phenyl -N-C(CH3) 4-CI-Phenoxy H 2,4-(F,F)-Phenyl -N-C(CH3) 4-CI-Phenoxy H 2,4-(F,F)-Phenyl -N-C(CH3) 4-CI-Phenoxy H 2,3-(CH,CI,CI,CI)-Phenyl -N-C(CH3) 4-CI-Phenoxy H 2,3-(CH,CI,CI,CI)-Phenyl -N-C(CH3) 4-CI-Phenoxy H 2,3-(CH3,OCH3)-Phenyl -N-C(CH3) 4-CI-Phenoxy H 2,3-(CH2,CI,CI)-Phenyl -N-C(CH3) Phenylthio H 2,3-(CH3,OCH3,OCH3,OCH3)-	50 65	45	35 40	30	25	20	15	10	5	
H 2-(N,N-Dimethylamino)-ethyl H 2-CH3-Phenyl H 2-CH3-Phenyl H 2,4-(CH3,CH3)-Phenyl H 2,4-(CH3,CH3,CH3)-Phenyl H 3-CF3-Phenyl H 3-CF3-Phenyl H 2-C1-Phenyl H 2-C1-Phenyl H 2,4-(F,F)-Phenyl H 2,4-(F,F)-Phenyl H 2,3,5-(C1,C1,C1)-Phenyl H 2,3,5-(CH3,OCH3)-Phenyl H 2,3,5-(CH3,OCH3)-Phenyl H 2,4-(F,F)-Phenyl H 2,4-(F,F)-Phenyl H 2,5-(OCH3,OCH3)-Phenyl H 2,5-(OCH3,OCH3)-Phenyl H 2-CCH3-Phenyl H 2-CCH0-Phenyl H 2-CCH0-Phenyl H 2-CCH0-Phenyl H 2-CCH0-Phenyl H 2-CCH0-Phenyl	R	€	∝			RS			×	>
H 2-(N,N-Dimethylamino)-ethyl H Phenyl H 2-CH3-Phenyl H 2-CH3-Phenyl H 2-CH3-Phenyl H 2,3,5-(CH3,CH3)-Phenyl H 2,3,5-(CH3,CH3)-Phenyl H 2,4-(F,F)-Phenyl H 2-C1-Phenyl H 2-C1-Phenyl H 2-C1-Phenyl H 2-C1-Phenyl H 2-CN-Phenyl H 2,3,5-(C1,C1,C1)-Phenyl H 2,3,5-(C1,C1,C1)-Phenyl H 2,3-(OCH3,OCH3)-Phenyl H 2,3-(OCH3,OCH3)-Phenyl H 2,3-(OCH3,OCH3)-Phenyl H 2-SCH3-Phenyl H 2-CHO-Phenyl H 2-CHO-Phenyl H 2-CHO-Phenyl H 3-CCH3-Phenyl H 3-CCH3-Phenyl H 3-CCH3-Phenyl										
H Pheny1 H 2-CH ₃ -Pheny1 H 4-CH ₃ -Pheny1 H 2,4-(CH ₃ , CH ₃)-Pheny1 H 2,4-(CH ₃ , CH ₃)-Pheny1 H 3-CF ₃ -Pheny1 H 3-F-Pheny1 H 2-C1-Pheny1 H 2-CH0-Pheny1 H 2-CH0-Pheny1 H 2-CH0-Pheny1 H 2-CH0-Pheny1 H 2-CH0-Pheny1 H 2-CH0-Pheny1	Ethinyl	I	2-(N,N-Dimeth	/lamino)-ethy	_	-N=C (CH3) 2			0	-0
H 2-CH ₃ -Phenyl H 4-CH ₃ -Phenyl H 2, 4-(CH ₃ , CH ₃)-Phenyl H 2, 4-(CH ₃ , CH ₃)-Phenyl H 2, 5, 5-(CH ₃ , CH ₃)-Phenyl H 3-F-Phenyl H 2-C1-Phenyl H 2-C1-Phenyl H 2, 4-(F,F)-Phenyl H 2, 3, 5-(C1, C1)-Phenyl enoxy H 2, 3, 5-(C1, C1)-Phenyl H 2, 3, 5-(C1, C1)-Phenyl hio H 2, 3-(OCH ₃ , OCH ₃)-Phenyl H 2, 3-(OCH ₃ , OCH ₃)-Phenyl hio H 2, 2-(CH ₃ -Phenyl H 3, 4, 5-(OCH ₃ , OCH ₃)-Phenyl hio H 2-SCH ₃ -Phenyl H 2, 4-(SCH ₃ , SCH ₃)-Phenyl hio H 2-SCH ₃ -Phenyl H 2, 4-(NO ₂ , NO ₂)-Phenyl H 2-CHO-Phenyl H 3-COCH ₃ -Phenyl	Ethinyl	I	Phenyl			-N=C (CH ₃) ₂			0	0
H 4-CH ₃ -Pheny1 H 2,4-(CH ₃ , CH ₃)-Pheny1 H 2,4-(CH ₃ , CH ₃)-Pheny1 H 3-F-Pheny1 H 2-C1-Pheny1 H 2-CN-Pheny1 H 2-CH-Pheny1 H 2-CH-Pheny1 H 2-CHO-Pheny1 H 2-CHO-Pheny1 H 2-CHO-Pheny1 H 2-CHO-Pheny1 H 2-CHO-Pheny1 H 2-CHO-Pheny1	Ethinyl	I	2-CH ₃ -Pheny l			-N=C (CH3) 2			0	0
H 2,4-(CH ₃ , CH ₃)-Phenyl H 2,3,5-(CH ₃ , CH ₃)-Phenyl H 3-CF ₃ -Phenyl H 2-C1-Phenyl H 2-C1-Phenyl H 2-C1-Phenyl H 2,4-(F,F)-Phenyl H 2,4-(F,F)-Phenyl H 2,3,5-(C1,C1)-Phenyl H 2,3-(CH ₃ , OCH ₃)-Phenyl H 2-CN-Phenyl H 2-CN-Phenyl H 2-CN-Phenyl H 2-CCH ₃ -Phenyl H 2-CCH ₃ -Phenyl H 2-CCH ₃ -Phenyl H 2-SCH ₃ -Phenyl H 2-CCH ₃ -Phenyl	Ethinyl	I	4-CH ₃ -Phenyl			-N=C (CH ₃) ₂			0	0
H 2,3,5-(CH ₃ , CH ₃)-Phenyl H 3-CF ₃ -Phenyl H 3-F-Phenyl H 2-C1-Phenyl H 2-C1-Phenyl H 2,4-(F,F)-Phenyl H 2,3-(C1,C1,C1)-Phenyl H 2,3,5-(C1,C1,C1)-Phenyl H 2,3-(OCH ₃ -Phenyl H 2,3-(OCH ₃ -Phenyl H 2,3-(OCH ₃ -Phenyl H 2,5-(OCH ₃ ,OCH ₃)-Phenyl H 2,5-(OCH ₃ ,OCH ₃)-Phenyl H 2,4-(F,F)-Phenyl	Methoxy	I	2, 4-(CH ₃ , CH ₃)	-Phenyl		-N=C (CH ₃) ₂			0	0
H 3-CF3-Phenyl H 2-CI-Phenyl H 2-CI-Phenyl H 2-CI-Phenyl H 2,4-(F,F)-Phenyl H 2,4-(F,F)-Phenyl H 2,3,5-(CI,CI,CI)-Phenyl H 2,3,5-(CI,CI,CI)-Phenyl H 2,3-(OCH3,OCH3)-Phenyl H 2,3-(OCH3,OCH3)-Phenyl H 2,3-(OCH3,OCH3)-Phenyl H 2,5-(OCH3,OCH3)-Phenyl H 2,5-(OCH3,OCH3)-Phenyl H 2,4-(SCH5-Phenyl H 2-SCF3-Phenyl H 2-SCF3-Phenyl H 2-SCF3-Phenyl H 2-CHO-Phenyl H 2-CHO-Phenyl H 2-CHO-Phenyl H 3-COCH3-Phenyl H 3-COCH3-Phenyl	Methoxy	I	2, 3, 5- (cH ₃ , CH	3, CH3)-Pheny1		-N=C (CH3) 2			0	0
H 3-F-Pheny1 H 2-C1-Pheny1 H 2-C1-Pheny1 H 2,4-(F,F)-Pheny1 H 2,3,5-(C1,C1,C1)-Pheny1 H 2,3,5-(C1,C1,C1)-Pheny1 H 2-CN-Pheny1 H 2-CN-Pheny1 H 2-CN-Pheny1 H 2,3-(CCH ₃ ,OCH ₃)-Pheny1 H 2,3-(OCH ₃ ,OCH ₃)-Pheny1 H 2,3-(OCH ₃ ,OCH ₃)-Pheny1 H 2,5-(OCH ₃ ,OCH ₃)-Pheny1 H 2-SCH ₃ -Pheny1 H 2-SCH ₃ -Pheny1 H 2-SCF ₃ -Pheny1 H 2-CH ₂ -Pheny1 H 3-CCH ₃ -Pheny1	Methoxy	I	3-CF ₃ -Phenyl			-N=C (CH3) 2			0	0
enoxy H 2-C1-Phenyl H 4-C1-Phenyl enoxy H 2,4-(F,F)-Phenyl enoxy H 2,3,5-(C1,C1,C1)-Phenyl H 2-CN-Phenyl H 2-CN-Phenyl H 2,3-(OCH ₃ ,OCH ₃)-Phenyl H 2,3-(OCH ₃ ,OCH ₃)-Phenyl hio H 2,3-(OCH ₃ ,OCH ₃)-Phenyl hio H 2,5-(OCH ₃ ,OCH ₃)-Phenyl hio H 2-SCF ₃ -Phenyl H 2,4-(SCH ₃ ,SCH ₃)-Phenyl hio H 2-SCF ₃ -Phenyl H 2,4-(NO ₂ ,NO ₂)-Phenyl H 2,4-(NO ₂ ,NO ₂)-Phenyl H 2,4-(NO ₂ ,NO ₂)-Phenyl H 2-CHO-Phenyl H 2-CHO-Phenyl H 3-CCH ₃ -Phenyl H 2-CHO-Phenyl H 3-CCH ₃ -Phenyl	Methoxy	Ŧ	3-F-Phenyl			-N=C (CH3) 2			0	0
enoxy H 2,4-(F,F)-Phenyl enoxy H 2,3,5-(Cl,Cl,Cl)-Phenyl enoxy H 2-CN-Phenyl H 2-CN-Phenyl H 2-OCH ₃ -Phenyl H 2,3-(OCH ₃ ,OCH ₃)-Phenyl enoxy H 2,3-(OCH ₃ ,OCH ₃)-Phenyl H 2,4-(OCH ₃ ,OCH ₃)-Phenyl hio H 2-SCH ₃ -Phenyl H 2-SCH ₃ -Phenyl hio H 2-SCF ₃ -Phenyl H 2,4-(SCH ₃ ,SCH ₃)-Phenyl H 2,4-(SCH ₃ ,SCH ₃)-Phenyl H 2,4-(NO ₂ -Phenyl H 2,4-(NO ₂ -Phenyl H 2,4-(NO ₂ -Phenyl H 2,4-(NO ₂ -Phenyl H 3-CCHO-Phenyl H 3-CCHO-Phenyl	Methoxy	I	2-C1-Phenyl			-N=C (CH3) 2			0	0
H 2, 4-(F,F)-Phenyl H 2,3,5-(C1,C1)-Phenyl H 2-CN-Phenyl H 2-OCH ₃ -Phenyl H 2,3-(OCH ₃ ,OCH ₃)-Phenyl H 2,3-(OCH ₃ ,OCH ₃)-Phenyl H 3,4,5-(OCH ₃ ,OCH ₃)-Phenyl H 2-OCF ₂ -Phenyl H 2-CCF ₃ -Phenyl H 2-SCH ₃ -Phenyl H 2,4-(SCH ₃ ,SCH ₃)-Phenyl H 2,4-(NO ₂ -Phenyl H 2,4-(NO ₂ -Phenyl H 2,4-(NO ₂ -Phenyl H 2,4-(NO ₂ -Phenyl H 2,4-(NO ₂)-Phenyl H 2-CCHO-Phenyl H 3-CCH ₃ -Phenyl	Methoxy	I	4-Cl-Phenyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0
H 2,3,5-(C1,C1)-Phenyl H 2-CN-Phenyl H 2-OCH ₃ -Phenyl H 2,3-(OCH ₃ ,OCH ₃)-Phenyl H 2,3-(OCH ₃ ,OCH ₃)-Phenyl H 3,4,5-(OCH ₃ ,OCH ₃)-Phenyl H 3-OCF ₃ -Phenyl H 2-SCH ₃ -Phenyl H 2-SCH ₃ -Phenyl H 2,4-(SCH ₃ ,SCH ₃)-Phenyl H 2-SCF ₃ -Phenyl H 2-CCH ₂ -Phenyl H 2-CCH ₂ -Phenyl H 2-CCH ₃ -Phenyl H 2,4-(NO ₂ ,NO ₂)-Phenyl H 2,4-(NO ₂)-Phenyl	4-C1-Phenoxy	I	2, 4-(F, F)-Phe	lųı		-N=C(CH3)2			0	0
H 2-CN-Phenyl H 2-OCH ₃ -Phenyl H 2,3-(OCH ₃ , OCH ₃)-Phenyl H 2,4-(OCH ₃ , OCH ₃ , OCH ₃)-Phenyl H 3-OCF ₃ -Phenyl H 2-OCF ₂ CHF ₂ -Phenyl H 2-SCH ₃ -Phenyl H 2-SCH ₃ -Phenyl H 2,4-(SCH ₃ , SCH ₃)-Phenyl H 2-CCF ₃ -Phenyl H 3-CCCH ₃ -Phenyl	4-C1-Phenoxy	I	2, 3, 5- (c1, c1,	 Phenyl 		-N=C(CH3)2			0	0
H 2-0CH ₃ -Pheny ¹ H 2,3-(0CH ₃ , 0CH ₃)-Pheny ¹ H 3,4,5-(0CH ₃ , 0CH ₃ , 0CH ₃)-Pheny ¹ H 3-0CF ₃ -Pheny ¹ H 4-0CF ₂ CHF ₂ -Pheny ¹ H 2-SCH ₃ -Pheny ¹ H 2,4-(SCH ₃ , SCH ₃)-Pheny ¹ H 2-SCF ₃ -Pheny ¹ H 2-SCF ₃ -Pheny ¹ H 2-CHO ₂ -Pheny ¹ H 2,4-(NO ₂ , NO ₂)-Pheny ¹ H 2-CHO-Pheny ¹ H 3-COCH ₃ -Pheny ¹	4-C1-Phenoxy	I	2-CN-Phenyl			-N=C(CH3)2			0	0
H 2,3-(0CH ₃ , 0CH ₃)-Phenyl H 3,4,5-(0CH ₃ , 0CH ₃)-Phenyl H 3-0CF ₃ -Phenyl H 4-0CF ₂ CHF ₂ -Phenyl H 2-SCH ₃ -Phenyl H 2,4-(SCH ₃ , SCH ₃)-Phenyl H 2-SCF ₃ -Phenyl H 2-CF ₃ -Phenyl H 2-CH ₃ -Phenyl H 2-CCH ₃ -Phenyl H 2-CCH ₃ -Phenyl H 2-CCH ₃ -Phenyl H 3-CCH ₃ -Phenyl	4-C1-Phenoxy	I	2-0CH ₃ -Phenyl			-N=C (CH3) 2			0	0
xy H 3,4,5-(0CH ₃ ,0CH ₃)-Phenyl H 3-0CF ₃ -Phenyl H 4-0CF ₂ CHF ₂ -Phenyl H 2,4-(SCH ₃ ,SCH ₃)-Phenyl H 2,4-(SCH ₃ ,SCH ₃)-Phenyl H 2-SCF ₃ -Phenyl H 4-NO ₂ -Phenyl H 2-CHO-Phenyl H 2-CHO-Phenyl H 2-CHO-Phenyl H 3-CCH ₃ -Phenyl	4-C1-Phenoxy	I	2, 3-(0CH ₃ , 0CH	3)-Phenyl		-N=C(CH3)2			0	0
H 3-0CF ₃ -Phenyl H 4-0CF ₂ CHF ₂ -Phenyl H 2-SCH ₃ -Phenyl H 2,4-(SCH ₃ , SCH ₃)-Phenyl H 2-SCF ₃ -Phenyl H 4-NO ₂ -Phenyl H 2,4-(NO ₂)-Phenyl H 2,4-(NO ₂)-Phenyl H 2-CHO-Phenyl H 3-CCH ₃ -Phenyl	4-C1-Phenoxy	=	3, 4, 5- (осн ₃ , о	:H3, ОСН3)-Phe	ny 1	-N=C(CH3)2			0	0
H 4-0CF ₂ CHF ₂ -Phenyl H 2-SCH ₃ -Phenyl H 2,4-(SCH ₃ , SCH ₃)-Phenyl H 2-SCF ₃ -Phenyl H 4-NO ₂ -Phenyl H 2,4-(NO ₂)-Phenyl H 2,4-(NO ₂)-Phenyl H 2-CHO-Phenyl H 3-COCH ₃ -Phenyl	Phenylthio	I	3-0CF ₃ -Phenyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0
H 2-SCH ₃ -Phenyl H 2,4-(SCH ₃ , SCH ₃)-Phenyl H 2-SCF ₃ -Phenyl H 4-NO ₂ -Phenyl H 2,4-(NO ₂)-Phenyl H 2,4-(NO ₂)-Phenyl H 2-CHO-Phenyl H 3-COCH ₃ -Phenyl	Phenylthio	I	4-0CF 2CHF 2-Ph	any 1		-N=C(CH3)2			0	0
H 2,4-(SCH ₃ ,SCH ₃)-Phenyl H 2-SCF ₃ -Phenyl H 4-NO ₂ -Phenyl)-Phenyl H 2,4-(NO ₂ ,NO ₂)-Phenyl)-Phenyl H 2-CHO-Phenyl)-Phenyl H 3-COCH ₃ -Phenyl	Phenylthio Phenylthio	I	2-SCH ₃ -Phenyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0
H 2-SCF ₃ -Phenyl H 4-NO ₂ -Phenyl)-Phenyl H 2, 4-(NO ₂) -Phenyl)-Phenyl H 2-CHO-Phenyl)-Phenyl H 3-COCH ₃ -Phenyl	Phenylthio	I	2, 4-(SCH ₃ , SCH	3)-Phenyl		-N=C(CH ₃) ₂			0	0
H 4-NO ₂ -Phenyl)-Phenyl H 2,4-(NO ₂ ,NO ₂)-Phenyl)-Phenyl H 2-CHO-Phenyl)-Phenyl H 3-COCH ₃ -Phenyl	Phenylthio	I	2-SCF ₃ -Phenyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0
H 2,4-(NO ₂ ,NO ₂)-Phenyl H 2-CHO-Phenyl H 3-COCH ₃ -Phenyl	Phenylthio	I	4-NO ₂ -Phenyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0
H 2-CHO-Phenyl H 3-COCH ₃ -Phenyl	2, 4-(C1, C1)-Phenyl	I	2, 4-(NO ₂ , NO ₂)	-Phenyl		-N=C(CH ₃) ₂	_		0	0
I 3-COCH ₃ -Phenyl	2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl	I	2-CHO-Phenyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0
	2,4-(Cl,Cl)-Phenyl	I	3-COCH ₃ -Pheny	_		-N=C(CH ₃) ₂			0	0

<i>50</i>	4 5	40	35	30	25	20	15	10	5		
R1		R3	R 4			RS			*	>	
		•	1000			- N-0 (CH -) -			0	c	
2, 4-(CI, CI)-Pheny I	neny!	z :	3-cocr3-rueny:			-N=C(CH3)2 -N=C(CH3)2			0	Ō	
2, 4-(C1, C1)-Pheny I	neny i	E :	I-naphrnyt			2 (5113) 2			ج د		
2, 4-(c1, c1)-f	Pheny 1	I	2-Naphthyl			-N=C(CH3)2			> (,	
2-Thienyl		I	Piperidino			-N=C(CH ₃) ₂			0	0	
2-Thienyl		=	3-Tetrahydrofuranyl	any l		-N=C(CH3)2			0	0	
2-Thienvl		Ŧ	4-Tetrahydropyranyl	any l		-N=C (CH3) 2			0	0	
2-Thienvl		=	2-Thiazolyl			-N=C(CH3)2			0	0	
2-Thienv]		Ŧ	5-CH3-2-Thiazolyl	~		-N=C(CH ₃) ₂			0	0	
2-Thienv]		=	4-CH3-5-COOH-2-Thiazoly	Thiazolyl		-N=C(CH3)2			0	0	
3-Pvridvl		<u> </u> =	Methyl			-N=C(CH3)2			0	0	
3-Pyridyl		±	Ethyl			-N=C(CH3)2			0	0	
3-Pyridyl		Ŧ	n-Propyl			-N=C(CH3)2			0	0	
3-Pyridyl		I	iso-Propyl			-N=C(CH3)2			0	0	
3-Pyridyl		I	n-Butyl			-N=C(CH3)2			0	0	
3-Pvridvl		I	iso-Butyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0	
iso-Propyl		Methyl	sekButyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0	
iso-Propyl		Methyl	n-Pentyl			-N=C(CH3)2			0	0	
iso-Propvl		Methyl	2-Pentyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0	
iso-Propyl		Methyl	3-Pentyl			-N=C (CH3) 2			0	0	
iso-Propvl		Methyl	n-Hexyl			-N=C (CH3) 2			0	0	
iso-Pronvi		Methyl	2-Hexyl			-N=C (CH3) 2			0	0	
iso-Pronvl		Methyl				-N=C (CH3)2			0	0	
Methyl		· =	tertButyl			2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl	Phenyl		0	S	
Methyl	-	I	tertButyl			2-Pyridyl			0	S	
Methyl		I	tertButyl	-		Ethyl			0	S	
,											

50	45	40	35	30	25	20	15	10		5
R1		R3	R4			R5			×	>
		:							(
Metnyl		I	tertButyl			1so-Propy I			0	'n
Methyl		I	tertButyl			Butyl			0	S
Methyl		I	tertButyl			tertButyl			0	S
Methyl		I	tertButyl			Phenyl			0	S
iso-Propyl		I	tertButyl			4-F-Phenyl			0	S
iso-Propyl		I	tertButyl			3-CF ₃ -Phenyl	_		0	S
iso-Propyl		Ŧ	tertButyl			2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl	-Pheny1		0	S
iso-Propyl		I	tertButyl			2-Pyridyl			0	S
iso-Propyl		I	tertButyl			Methyl			0	S
iso-Propyl		Ŧ	tertButyl			Ethy1			0	ഗ
iso-propyl		I	tertButyl			iso-Propyl			0	Ŋ
cyclo-Propyl		I	tertButyl			Butyl			0	S
cyclo-Propyl		Ŧ	tertButyl			tertButyl			0	S
cyclo-Proply	-	Ŧ	tertButyl			Pheny 1			0	S
cyclo-Propyl		I	tertButyl			4-F-Phenyl			0	S
cyclo-Propyl		I	tertButyl			3-CF3-Phenyl			0	S
cyclo-Propyl		I	tertButyl			2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl	-Phenyl		0	S
cyclo-Propyl		I	tertButyl			2-Pyridyl			0	S
Allyl		Ŧ	tertButyl			Methy1			0	ဟ
Allyl		I	tertButyl			Ethyl			0	S
Allyl		I	tertButyl			iso-Propyl			0	S
Allyl		I	tertButyl			Butyl			0	S
Allyl		I	tertButyl			tertButyl	÷		0	S
Allyl		I	tertButyl			Phenyl			0	S
Methoxy		I	tertButyl			Methyl			0	S

50 55	45	40		35	30	25	20	15	10	5	
R1		R3	4				R5			×	>
		•	4444				n+hu]			c	t.
Methoxy		= 3	+00+	16.7			iso-Pronvl				ص
Methoxy		E =	ter tbuty	16.7		-	150 11 opj.				· •
Methoxy		E :	tertbuty	ucy:		. •	bacy:				, u
Methoxy		=	tertButyl	luty I			tertbucy:				n (
Methoxy		I	tertButy	lutyl			Pheny1			0	ın ·
Methoxy		Ŧ	tertButy	lutyl			4-F-Pheny l			0	S
4-Cl-Phenoxy		.	tertButyl	lutyl			3-CF ₃ -Phenyl			0	S
4-Cl-Phenoxy		I	tertButyl	lutyl			2, 4-(C1, C1)-Phenyl	enyl		0	S
4-C1-Phenoxy		I	tertButy	lutyl			2-Pyridyl			0	s
4-Cl-Phenoxy		I	tertButy	utyl		-	Methy1			0	s
4-Cl-Phenoxy		I	tertButy	outyl			Ethyl			0	S
4-C1-Phenoxy		I	tertButy	utyl			iso-Propyl			0	S
4-Cl-Phenoxy		I	tertButy	lutyl			Butyl			0	S
2, 4-(C1, C1)-P	henyl	÷	tertButy	Jutyl			tertButyl			0	S
2, 4-(C1, C1)-Phenyl	henyl	Ξ	tertButy	Jutyl	•		Phenyl			0	s
2, 4-(c1, c1)-P	henyl	I	tertButy	Jutyl			4-F-Phenyl			0	S
2, 4-(C1, C1)-P	henyl	I	tertButy	3utyl			3-CF ₃ -Pheny1			0	S
2, 4-(01,01)-6	henyl	I	tertButy	3utyl .			2, 4-(C1, C1)-Phenyl	ieny l		0	S
2, 4-(C1, C1)-	Pheny 1	I	tertButy	3uty]			2-Pyridyl			0	S
2, 4-(C1, C1)-F	Pheny 1	=	tertButy	3uty]			Ethyl			0	S
2-Thienyl	,	, ±	tertButy	3uty]			iso-Propyl			0	S
2-Thienyl		I	tertButy	Butyl			Butyl			0	တ
2-Thienyl		I	tertButy	Butyl			tertButyl			0	S
3-Pyridyl		I	tertButy	Butyl			Phenyl			0	တ
3-Pyridyl		π	tertButyl	Butyl			4-F-Pheny l			0	S

50 65	4 5	40	40	35	30	25	20	15	10	5	
		æ	α 4				R S			×	>
											_
3-Pyridyl		I	tertButyl	Butyl			3-CF ₃ -Pheny1				· w
Methyl		I	cyclo-Propyl	Propyl			2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl	henyl	•	_	S
Methyl		I	cyclo-Propy	Propy1			2-Pyridyl			_	S
Methyl		I	cyclo-Propy	Propy1			Ethyl			0	s
Methyl		I	cyclo-Propyl	Propyl			iso-Propyl			0	s
Methyl		I	cyclo-Propyl	Propyl			Butyl			0	s
Methyl		I	cyclo-Propyl	Propyl			tertButyl			0	S
Methyl		I	cyclo-Propy	Propyl			Pheny 1		•	0	S
iso-Propyl		I	cyclo-Propy	Propy1			4-F-Phenyl			0	S
iso-Propyi		I	cyclo-Propy	Propyl			3-CF ₃ -Phenyl		•	0	S
1so-Propy1		I	cyclo-Propy	Propyl			2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl	henyl	•	0	S
iso-Propyl		I	cyclo-Propy	Propyl			2-Pyridyl			0	S
iso-Propyl		I	cyclo-Propy	Propyl			Methyl		-	0	S
iso-Propy1		I	cyclo-Propy	Propyl			Ethyl			0	S
iso-Propyl		I	cyclo-Propy	Propyl			iso-Propyl		•	0	S
cyclo-Propyl		I	cyclo-Propyl	Propyl			Butyl			0	S
cyclo-Propyl		I	cyclo-Propyl	Propyl			tertButyl			0	S
cyclo-Propyl		I	cyclo-Propy	Propyl			Phenyl			0	S
cvclo-Propyl		I	cyclo-Propy	Propyl			4-F-Phenyl		•	_	S
cvclo-Propvl		I	cyclo-Propy	Propyl			3-CF ₃ -Phenyl		•	_	S
cvclo-Propyl		I	cyclo-Propy	Propyl			2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl	henyl		0	S
cvclo-Propvl		x	cyclo-Propy	Propyl			2-Pyridyl			0	S
Allyl		I	cyclo-Propy	Propyl			Methyl			0	S
Allyl		I	cyclo-Propy	Propyl			Ethyl			0	S
Allyl		I	cyclo-Propy	Propyl			iso-Propyl			0	S

55	4 5	40		35	30	25	20	15	10	5	
						'	•				3
R1		R3	R4				R5			×	
,		:		-						0	_ _
Allyl		E	cyclo-riopy	1 640							
Allyl		=	cyclo-Propy	opyl		_	tertButyl			-	n
Allvl		I	cyclo-Propy	opyl		_	Phenyl			0	S
Methoxy		I	cyclo-Propy	opyl			Methyl			0	S
Methoxv		I	cyclo-Propy	opyl		_	Ethyl			0	S
Methoxy		I	cyclo-Propy	opyl			iso-Propyl			0	S
Methoxy		I	cyclo-Propy	opyl		_	Butyl			0	s
Methoxy		Ξ	cyclo-Propy	opyl		•	tertButyl			0	S
Methoxy		I	cyclo-Propyl	opyl		_	Pheny l			0	S
Methoxy		=	cyclo-Propyl	opyl			4-F-Pheny l			0	S
vxonehelj-4		I	cyclo-Propy	opyl			3-CF ₃ -Phenyl			0	s
4-C1-Phenoxy		I	cyclo-Propy	opyl			2,4-(Cl,Cl)-Phenyl	ınyl		0	S
4-C1-Phenoxy	,	I	cyclo-Propy	opyl			2-Pyridyl			0	S
4-C1-Phenoxy		I	cyclo-Propy	opyl			Methyl			0	S
4-C1-Phenoxy		I	cyclo-Propy	opyl			Ethyl			0	S
4-C1-Phenoxy		I	cyclo-Propyl	opy1			iso-Propyl			0	S
4-C1-Phenoxy		I	cyclo-Propy	opy l			Butyl			0	S
2.4-(C1.C1)-Pheny	nv1	I	cyclo-Propy	opy l			tertButyl			0	S
2 4-(C1 C1)-Pheny	. n. l	I	cyclo-Propy	opy l			Pheny l			0	S
2, 4-(Cl. Cl)-Pheny	[\u03b4	Ξ	cyclo-Propy	opy l			4-F-Phenyl			0	S
2, 4 (C1, C1) -Phe	[Au	I	cyclo-Propy	·opy l			3-CF ₃ -Phenyl			0	S
2,4 (C1,C1) -Pheny	iny]	I	cyclo-Propy	opy l			2, 4-(cl, cl)-Phenyl	ınyl		0	s
2,4 (C) (1) -Phe	. n.	I	cyclo-Propyl	opy l			2-Pyridyl			0	S
2, 4-(C1, C1)-Pheny	l hua	I	cyclo-Propyl	opy l			Ethyl			0	S
2-Thienyl	,	I	cyclo-Propyl	ropy1			iso-Propyl			0	S

5		>	o s	s 0	s 0	s 0	s o
15							_
20		RS	Butyl	tertButyl	Phenyl	4-F-Pheny l	3-CF ₃ -Pheny
25							
30	•		٠				
35		R+	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl
40		R3	I	I	Ŧ	×	I
45							
50			rhieny l	Thienyl	Pyridyl	Pyridyl	3-Pyridyl
55		7	2-1	2-1	3-1	<u>-</u> E	3-

Die Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide la und lb bzw. die sie enthaltenden herbiziden Mittel können beispielsweise in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen, auch hochprozentigen wäßrigen, öligen oder sonstigen Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, 5 Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln oder Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungformen richten sich nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

Die Verbindungen la und Ib eignen sich allgemein zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen. Als inerte Zusatzstoffe kommen Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanon, Cyclohexanon, Chlorbenzol, Isophoron oder stark polare Lösungsmittel, wie N,N-Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon oder Wasser in Betracht.

Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Dispersionen, Pasten, netzbaren Pulvern oder wasserdispergierbaren Granulaten durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substrate als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen die Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von aromatischen Sulfonsäuren, z.B. Lignin-, Phenol-, Naphthalin-und Dibutylnaphthalinsulfonsäure, sowie von Fettsäuren, Alkyl- und Alkylarylsulfonaten, Alkyl-, Laurylether- und Fettalkoholsulfaten, sowie Salze sulfatierter Hexa-, Hepta- und Octadecanolen, sowie von Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und seiner Derivate mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctyl-, Octyl- oder Nonylphenol, Alkylphenol-, Tributylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether oder Polyoxypropylen, Laurylalkoholpoly glykoletheracetat, Sorbitester, Lignin-Sulfitablaugen oder Methylcellulose in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind Mineralerden wie Silicagel, Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver oder andere feste Trägerstoffe.

Die Formulierungen enthalten zwischen 0,1 und 95 Gew.%, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.%, Wirkstoff. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90 % bis 100 %, vorzugsweise 95 % bis 100 % (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen la und Ib können beispielsweise wie folgt formuliert werden: I. Man vermischt 90 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 1.003 mit 10 Gewichtsteilen N-Methyl-α-pyrrolidon und erhält eine Lösung, die zur Anwendung in Form kleinster Tropfen geeignet ist.

II. 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 1.010 werden in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen Xylol, 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 5 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 5 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Richnusöl besteht. Durch Ausgießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtstellen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.% des Wirkstoffs enthält.

45

50

55

III. 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 1.004 werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 30 Gewichtsteilen Isobutanol, 20 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.% des Wirkstoffs enthält.

IV. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 1.011 werden in einer Mischung gelöst, die aus 25 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 65 Gewichtsteilen einer Mineralölfraktion vom Siedepunkt 210 bis 280°C und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch

Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.% des Wirkstoffs enthält.

- V. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 1.011 werden mit 3 Gewichtsteilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin-α-sulfonsäure, 17 Gewichtsteilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gewichtsteilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.% des Wirkstoffs enthält.
- VI. 3 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 1.003 werden mit 97 Gewichtsteilen feinteiligem Kaolin vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 3 Gew.% des Wirkstoffs enthält.
- VII. 30 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 1.004 werden mit einer Mischung aus 92 Gewichtsteilen pulverförmigem Kieselsäuregel und 8 Gewichtsteilen Paraffinöl, das auf die Oberfläche dieses Kieselsäuregels gesprüht wurde, innig vermischt. Man erhält auf diese Weise eine Aufbereitung des Wirkstoffs mit guter Haftfähigkelt.
- VIII. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 1.010 werden mit 2 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure, 8 Gewichtsteilen Fettalkohol-polyglykolether, 2 Gewichtsteilen Natriumsalz eines Phenol-Harnstoff-Formaldehyd-Kondensates und 68 Gewichtsteilen eines paraffinischen Mineralöls innig vermischt. Man erhält eine stablie ölige Dispersion.

Die Applikation der herbiziden Mittel bzw. der Wirkstoffe kann im Vorauflauf- oder im Nachauflaufverfahren erfolgen. Sind die Wirkstoffe für gewisse Kulturpflanzen weniger verträglich, so können Ausbringungstechniken angewandt werden, bei welchen die herbiziden Mittel mit Hilfe der Spritzgeräte so gespritzt werden, daß die Blätter der empfindlichen Kulturpflanzen nach Möglichkeit nicht getroffen werden, während die Wirkstoffe auf die Blätter darunter wachsender unerwünschter Pflanzen oder die unbedeckte Bodenfläche gelangen (post-directed, lay-by).

Die Aufwandmengen an Wirkstoff betragen je nach Bekämpfungsziel, Jahreszeit, Zielpflanzen und Wachstumsstadium 0,001 bis 5, vorzugsweise 0,01 bis 2 kg/ha aktive Substanz (a.S.).

In Anbetracht der Vielseitigkeit der Applikationsmethoden können die erfindungsgemäßen Verbindungen bzw. sie enthaltende Mittel in einer großen Zahl von Kulturplfanzen zur Beseitigung unerwünschter Pflanzen eingesetzt werden.

Zur Verbreiterung des Wirkungsspektrums und zur Erzielung synergistischer Effekte können die Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide la und Ib mit zahlreichen Vertretern anderer herbizider oder wachstumsregulierender Wirkstoffgruppen gemischt und gemeinsam ausgebracht werden. Beispielsweise kommen als Mischungspartner Diazine, 4H-3,1-Benzoxazinderivate, Benzothiadiazinone, 2,6-Dinitroaniline, N-Phenylcarbamate, Thiolcarbamate, Halogencarbonsäuren, Triazine, Amide, Harnstoffe, Diphenylether, Triazinone, Uracile, Benzofuranderivate, Cyclohexan-1,3-dionderivate, Chinolincarbonsäurederivate, Aryloxy-, Heteroaryloxyphenoxypropionsäuren sowie deren Salze, Ester und Amide und andere in Betracht.

Außerdem kann es von Nutzen sein, die Verbindungen la und Ib allein oder in Kombination mit anderen Herbiziden auch noch mit weiteren Pflanzenschutzmitteln gemischt gemeinsam auszubringen, beispielsweise mit Mitteln zur Bekämpfung von Schädlingen oder phytopathogenen Pilzen bzw. Bakterien. Von Interesse ist ferner die Mischbarkeit mit Mineralsalzlösungen, welche zur Behebung von Ernährungs-und Spurenelementmängeln eingesetzt werden. Es können auch nichtphytotoxische Öle und Ölkonzentrate zugesetzt werden.

Synthesebeispiele

45

5

10

15

30

35

Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in den nachstehenden Tabellen mit physikalischen Angaben aufgeführt.

50

1. Verfahren zur Herstellung der Vorprodukte

Beispiel 1.1

55

4(5)-Ethoxycarbonyl-2-methyl-oxazol-5-(4)-carbonsäure

Zu 33,8 g (0,15 mol) 2-Methyl-oxazol-4,5-dicarbonsäureester in 300 ml Ethanol tropfte man bei -10°C unter N2 innerhalb von 4 h eine Lösung von 6,0 g (0,15 mol) Natriumhydroxid in 150 ml Wasser und rührte 2 h bei -10°C nach. Man engte die Lösung ein, nahm den Rückstand in 300 ml Wasser auf, stellte mit Salzsäure auf pH = 8 bis 9 ein und extrahierte zweimal mit je 300 ml Diethylether. Anschließend säuerte man mit konz. HCl auf pH = 2 an und extrahierte die wäßrige Phase viermal mit je 250 ml Dichlormethan. Die vereinigten organischen Phasen wurden über Magnesiumsulfat getrocknet und das Solvens im Vakuum abgezogen. Man erhielt 26,4 g (88 %) 4(5)-Ethoxycarbonyl-2-methyl-oxazol-5-(4)-carbonsäure als weißen Feststoff (Isomerenverhältnis: 3:1 (1H-NMR, HPLC). Zu isomerenreiner 4-Ethoxycarbonyl-2-methyl-oxazol-5carbonsäure gelangte man durch fraktionierte Kristallisation aus Cyclohexan/ Ethylacetat 2:1 oder Säulenchromatographie an Kieselgel (Lösungsmittel: Toluol, THF, Eisessig (7:3:1). ¹H-NMR (250 MHz, D₆-DMSO); Hauptisomer: $\delta = 1.28$ (t; 3H), 2,52 (s; 3H), 4,30 (q; 2H), 14,00 (bs; 1H).

Beispiel 1.2

15

4-Ethoxycarbonyl-2-methylthio-thiazol-5-carbonsäure

Eine Lösung von 7,00 g (25 mmol) 2-Methylthio-thiazol-4,5-dicarbonsäurediethylester in 100 ml 20 Ethanol/Wasser (2:1) wurde bei Raumtemperatur innerhalb von einer Stunde mit einer Lösung von 1,10 g (27,5 mmol) Natriumhydroxid in 10 ml Wasser versetzt. Man rührte eine Stunde nach, entfernte dann das Lösungsmittelgemisch im Vakuum, nahm den Rückstand mit 100 ml Wasser auf, extrahierte einmal mit 50 ml Diethylether und säuerte die wäßrige Phase mit konzentrierter Salzsäure an. Das ausgefallene Produkt wurde abgesaugt und getrocknet.

Ausbeute: 4,50 g (73 %). Schmelzpunkt: 104 °C.

Die in der folgenden Tabelle genannten Carbonsäuren wurden gemäß dem vorstehenden Beispiel erhalten:

30	Beisp.	R¹	R⁵	X	phys. Daten
30	1.9(b)	Phenyl	CH ₃	s	Fp.: 127-137
	1.4(a)	n-Butylthio	C₂H₅	s	0,95 (t;3H), 1,40 (t;3H), 1,50(sext;2H), 1,80 (quint;2H), 3,40 (t;2H), 4,35 (q;2H)
35	1.5(b)	n-Butylthio	C ₂ H ₅	s	0,95 (t;3H), 1,35 (t;3H), 1,50 (sect;2H), 1,80 (quint;2H), 3,30 (t;2H), 4,45 (q;2H)
50	2.6(b)	iso-Propylthio	C ₂ H ₅	s	1,50 (d;6H), 1,45 (t;3H), 3,90 (hept;1H), 4,55 (q;2H), 12,50 (s;1H)
	1.7(a)	iso-Propylthio	C₂H₅	s	1,45 (t;3H), 1,50 (d;6H), 4,05 (hept;1H), 4,50 (q;2H), 12,50 (s;1H)
40	1.8(a)	Methylthio	CH₃	S	2,80 (s;3H), 4,05 (s;3H)

50

Beispiel 1.9

2-Methylthiothiazol-4,5-dicarbonsäure-diethylester

Eine Lösung von 9,2 g (0,03 mol) 2-Chlor-thiazol-4,5-dicarbonsäure-diethylester in 30 ml Ethanol wurde bei 0°C tropfenweise mit einer Lösung von 2,1 g (0,03 mol) Natrium-methylthiolat in 10 ml Ethanol versetzt. Man ließ das Gemisch auf 25°C erwärmen und rührte zwei Stunden nach. Danach entfernte man das Lösungsmittel bei vermindertem Druck, nahm den Rückstand in 100 ml Diethylether auf und wusch nacheinander mit je 50 ml 5 %iger Natronlauge und Wasser. Man trocknete über Natriumsulfat, engte ein und behielt 7,2 g (87 %) Produkt als farbloses Öl zurück.

¹H-NMR (CDCl₃, 250 MHz, TMS als interner Standard): 1,35 (t, J=7,0 Hz, 3H), 1,45 (t, J=7,0 Hz; 3H), 2,75 (s, 3H), 4.30 (q, J = 7.0 Hz; 2H), 4.50 (q, J = 7.0 Hz; 2H).

2. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen Vla und Vlb

Beispiel 2.1

10

2-Methoxythiazol-4-carbonsäure-tert.-butylamid

Eine Lösung von 12,00 g (46 mmol) 2-Brom-thiazol-4-carbonsäure-tert.-butylamid in 150 ml Methanol wurde bei 25°C mit 8,90 g einer 30 %igen Lösung (49 mmol) von Natriummethanolat in Methanol versetzt. Man hielt das Gemisch vier Stunden unter Rückfluß auf Siedetemperatur, engte dann die klare Lösung ein, nahm den Rückstand in 300 ml Diethylether auf, filtrierte und entfernte das Lösungsmittel bei vermindertem Druck. Man erhielt 9,60 g (98 %) Produkt als gelbes Öl.

14-NMR (CDCl₃, 250 MHz, TMS als interner Standard): 1,45 (s; 9H), 4,10 (s; 3H), 7,00 (s, breit, 1H), 7,48 (s;

11. 145 (s; 9H), 4,10 (s; 3H), 7,00 (s, breit, 1H), 7,48 (s; 1H).

Beispiel 2.2

2-Isopropyl-oxazol-4-carbonsäure-cyclopropylamid

Zu einer Lösung von 31,0 g (0,20 mol) 2-Isopropyl-oxazol-4-carbonsäure in 200 ml Toluol und 2 ml Dimethylformamid tropfte man bei Raumtemperatur 47,6 g (0,40 mol) Thionylchlorid und rührte 1 h bei 80°C. Man zog die Solventien im Vakuum ab, löste den Rückstand in 300 ml Dichlormethan und tropfte bei 0 bis 10°C 24,0 g (0,42 mol) Cyclopropylamin in 20 ml Dichlormethan zu. Man rührte 12 h bei Raumtemperatur, gab 150 ml Wasser zu, trennte die Phasen, wusch die organische Phase einmal mit gesättigter Natriumhydrogencarbonatlösung, trocknete über Magnesiumsulfat und zog das Solvens im Vakuum ab. Man erhielt 37,2 g (96 %) 2-Isopropyl-oxazol-4-carbonsäure-cyclopropylamid. 1 H-NMR (CDCl₃, 250 MHz): Δ = 0,62 (m; 2H), 0,88 (m; 2H), 1,34 (d; 6H), 2,86 (m; 1H), 3,09 (m; 1H), 6,93 (bs; 1H; NH), 8,09 (s; 1H).

Die in der folgenden Tabelle genannten Amide wurden gemäß den vorstehenden Beispielen oder analog der zitierten Literatur erhalten:

45

30

50

55

55	50	45	40	35	30	25	15 20	10	5
A.	R1		æ 3	A.		×	phys. Daten [Fp. (°C); NMR (& in ppm)]	(0 in ppm)]	
2.3(a)	Phenylthio		×	tertButyl		w	1,50 (s;9H), 7 7,65 (m;2H), 7	1,50 (s;9H), 7,00 (s;1H), 7,45 (m;3H), 7,65 (m;2H), 7,85 (s;1H)	(m;3H),
2.4(a)	Brom		I	tertButyl		S	L9- 79		
2.5(a)	Phenyl		I	4-Cl-Phenyl		vs	223		
2.6(a)	Brom		Ŧ	cyclo-Propyl		S	83-88		
2.7(a)	Methoxy		Ŧ	cyclo-Propyl		S	62-65		
2.8(a)	Methyl		I	tertButyl		S	1,48 (s;9H), 2,72 (s;3H),	,72 (s;3н),	
							7,25 (s;1H,NH), 7,91 (s;1H)	, 7,91 (s;1н)	
2.9(a)	Phenyl		I	tertButyl		ဟ	1,50 (s;9H), 7	1,50 (s;9H), 7,40 (s;1H,NH),	
							の(色) 06 '/-0+'/	/' #0-/' 90 (B;2H)' 8'03 (S;1H)	
2.10(b)	Methoxy		I	tertButyl		S	126-129		
2.11(a)	Methyl		I	tertButyl		0	60- 63		
2,12(a)	cvclo-Propvl	bvl	I	tertButyl		0	72- 74		
2 13(a)	Fthvl	•	I	tertButyl		0	1,36 (t;3H), 1	,48 (s;9H), 2,80	(ф;2н),
(B)CI:7	. ()		į				6,78 (s;1H, NH	(s;1H, NH), 8,01 (s;1H)	
2.14(a)	Ethvl		I	cyclo-Propyl		0	50- 55		
2.15(a)	Ethvl		I	3-CF ₃ -Phenyl		0	40- 43		
2.16(a)	iso-Propyl	ļ	I	tertButyl		0	1,36 (d;6H), 1,48 (s;9H), 3, 6 78 (s:1H.NH), 8.00 (s:1H)	1,36 (d;6H), 1,48 (s;9H), 3,06 (m;1H), 6 78 (s:1H.NH), 8.00 (s:1H)	(m;1H),
(4)(1)	iso-Pronvi	ب	I	cyclo-Propyl		0	0, 58-0, 96 (m;4F	_	2,86 (m;
(B) (1.7		•		•			1H), 3,08 (m;1	3,08 (m;1H), (s;1H,NH), 8	, 09 (s,1н)
2,18(a)	iso-Propy		Ξ	iso-Propy1		0	38- 41		
2,19(a)	cvclo-Propy	l Adi	I	iso-Propyl		0	27- 60		
2 20(a)	cvclo-Propvl	i va	I	cyclo-Propyl		0	80-83		
2.20(4)	cyclo-propyl	. C.	I	4-C1-Phenyl		0	147-150		
(p)17·7	oluku	. 64	:						

55	50	45	40	35	30	25	20	15	10	5
Nr.	R1		R3	R4.		*	phys. Daten [Fp. (°C);	Daten (°C); NMR (Ø in ppm)]	in ppm)]	-
2.22(a)	Pheny l		Ŧ	tertButyl		0	90- 93			·
2.23(a)	Pheny 1		I	iso-propyl	•	0	68- 7			
2.24(a)	Phenyl		I	cyclo-Propyl		0	7 6 -06	. #		
2.25(a)	Pheny 1		I	3-CF ₃ -Phenyl		0	127-129	•		
2.26(a)	Methyl		I	cyclo-Propyl		S	109-114	.		
2.27(a)	p-F-Benzyl	-	I	tertButyl		S	63- 64			
2.28(a)	2,6-C1,C1-Benzyl	-Benzyl	I	Cy anomethy l		S	82-85	10		
2.29(a)	tertButyl	, lk	I	tertButyl		S	85- 86	9		
2.30(a)	2-Pyridyl	,	Œ	tertButyl		s	93			
2.31(a)	3-CF ₃ -Benzyl	zyl	I	tertButyl		S	66 -76	0		
2.32(a)	2-Phenyl-ethyl	ethyl	I	Cyano-methyl		S	100			
2.33(a)	4-Cl-Phenoxy-meth	oxy-methyl	I	tertButyl		S	102			
2.34(a)	2,6-C1,C1-Benzyl	-Benzyl	I	tertButyl		S	105-106	90		
2.35(a)	Benzyl	ı	I	tertButyl		S	1,48	1,48 (s;9H), 4,30		
	•						7,15-7	',15-7,42 (m;6H),	7,90 (s;1н)	T
2.36(a)	2-Methoxy-ethyl	-ethyl	I	tertButyl		S	1,48 (3,75 ((s;9H), 3,25 (t;2H), 7,25	(t;2H), (s;1H),	(t;2H), 3,4 (s;3H), (s;1H), 7,95 (s;1H)
2.37(a)	2, 4-Cl, Cl-Benzyl	-Benzy1	I	tertButyl		S		,48 (s;9H), 4,40 ,13-7,48 (m;4H),	(s;2H), 7,92 (s;1H)	£
2.38(a)	2-Phenyl-ethyl	ethyl-	x	tertButyl		S	1,48 (7,10-7	,48 (s;9H), 3,10 7,10-7,50 (m;6H),	(t;2H), 3,30 7,90 (s;1H)	,30 (t;2H) H)
2.39(a)	Methyl-thiomethyl	ıiomethyl	I	tertButyl		S	1,48 (7,20 ((s;9H), 2,16 (s;1H), 8,00	(s;3H), (s;1H)	3,95 (s;2н)
2.40(a)	tertButyl	ty 1	I	tertButyl		v		(s;9H), 3,86 (s;1H)		(s;9H), 7,20 (s;1H)

55	50	4 5	4 0	35	30	25	20	15	10	5	
N.	R 1		. S. 3	4.5		*	phys. [Fp.	phys. Daten [Fp. (°C); NMR	phys. Daten [Fp. (°C); NMR (ø in ppm)]		
2.41(a)	Methoxymethyl	thy 1	I	tertButyl	_	s	1,49	1,49 (s;9H), 3,52 (s;3H) 7,10 (s;1H), 8,04 (s;1H)	1,49 (s;9H), 3,52 (s;3H), 4,7 (s; 2H), 7.10 (s;1H), 8,04 (s;1H)	7 (s;	2H),
2.42(a)	l-Phenyl-ethyl	ethyl	I	tertButyl	_	S	1,48	(s,9H), 1, -7,43 (m,6H	1,48 (s,9H), 1,76 (d;2H), 4,43 (q; 1H), 7,15-7,43 (m;6H), 7,93 (s;1H)	,43 (q 1)	; IH)
2.43(a)	cyclo-Hex	yl	I	cyclo-Propyl	yl	0	88- 91	91			
2.44(a)	cvclo-Hexyl	. [I	tertButyl	_	0	76- 50	20			
2.45(a)	n-Propyl	,	I	tertButyl	-	0	1,00		1,44 (s;9H), 1,81 (m; 2H),	E)	; 2H)
	2						2,74 8.05	2,74 (t;2H), 6, 8.05 (s;1H)	75 (bs;1H),NF	<u>`</u>	
7 46(2)	n-Propv]		Ξ	cyclo-Propyl	ıyı	0	54.	54- 57			
(a) (2, c)	n-Propv]		Ŧ	2, 4-(CH ₃) ₂ -Phenyl	-Phenyl	0	· † †	L4 -44			
(5) (7) (4-C1-Phen	[^1	I	cyclo-Propyl	ıy1	0	164	164-166			
(B)04.7 (C)07.6	4-C1-Phenyl		: =	tertButyl	-	0	131	131-133			
(a) (c+.2	4-C1-Phen		Ŧ	iso-Propyl		0	101	101-105			
2.50(a) 2.51(a)	4-Cl-Phenyl	, <u>^</u>	I	4-Cl-Phenyl	-	0	165	165-168			
2.52(a)	Methoxymethy	ethyl	I	tertButyl	Į.	0	1,46	(s;9H), 3, (bs:1H.NH)	1,46 (s;9H), 3,50 (s;3H), 4,50 (s;2H), 6.80 (bs:1H.NH), 8,12 (s;1H)	s) 05 ((;2H),
3 53(3)	+0+ -B11+v	- ·	Ι	tertButyl		0	83-	- 87			
2.33(a) 2.54(a)	tert - Buty	 	: =	cyclo-Propyl	y l	0	78	78-80			
2 55(2)	tert Buty	. [^+	=	CH(cyc10-1	CH(cyclo-Propyl) 2CH3	0	132	132-134			
(6)56.2	Methoxymethyl	cj. ethvl	=	cyclo-Propyl	lko	0	09'0	-0,90 (m;4t	0,60-0,90 (m;4H), 2,88 (m;1H),	Ŧ	
(B)0c.2	Me choy)	. ()		•	1		3,44	3,44 (s;3H), 4,53 (s;2H),	53 (s;2H),		
							6,94	(bs;1H,NH)	6,94 (bs;1H,NH), 8,21 (s;1H)	_	

3. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und Ib

Beispiel 1

5

4-Cyclopropylaminocarbonyl-2-isopropyl-oxazol-5-carbonsäure

Zu einer Lösung von 10,4 g (0,054 mol) 2-Isopropyl-oxazol-4-carbonsäurecyclopropylamid in 250 ml Tetrahydrofuran tropfte man unter Stickstoffatmosphäre bei -70° C 0,12 mol n-Butyllithium (80,0 ml einer 1,5 molaren Lösung in Hexan) und rührte 30 min bei dieser Temperatur. Anschließend goß man das Reaktionsgemisch auf 500 g festes CO₂ und ließ über Nacht stehen. Man engte ein, nahm den Rückstand in 200 ml Wasser und 30 ml 2N NaOH auf, extrahierte zweimal mit je 100 ml Diethylether, säuerte die wäßrige Phase mit konz. Salzsäure auf pH 2 an und extrahierte dreimal mit je 200 ml Ethylacetat. Man trocknete über Magnesiumsulfat und zog das Solvens im Vakuum ab.

Man erhielt 10,4 g (81 %) 4-Cyclopropylaminocarbonyl-2-isopropyl-oxazol-5-carbonsäure als weißes Pulver vom Smp. 109 bis 112 °C.

(Wirkstoffbeispiel 3.007).

Beispiel 2

25

40

45

20

4-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methoxy-thiazol-5-carbonsäure

Zu einer Lösung von 8,00 g (37 mmol) 2-Methoxy-thiazol-4-carbonsäure-tert.-butylamid in 150 ml
Tetrahydrofuran tropfte man bei -70° C 65 ml einer 1,5 m Lösung (97 mmol) von n-Butyllithium in n-Hexan
und rührte 30 Minuten bei dieser Temperatur. Anschließend goß man das Reaktionsgemisch auf 500 g
festes Kohlendioxid und ließ innerhalb von 14 Stunden auf Raumtemperatur erwärmen. Man entfernte das
Lösungsmittel im Vakuum, nahm den Rückstand in einer Mischung aus 150 ml Wasser und 16 ml 2 m
Natronlauge auf, filtrierte, säuerte das Filtrat mit konzentrierter Salzsäure an und saugte die ausgefallene
Carbonsäure ab.

Man erhielt 7,80 g (82 %) 4-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methoxythiazol-5-carbonsäure als weißes Pulver vom Fp.: 120 bis 122 °C. (Wirkstoffbeispiel 1.003).

Beispiel 3

5-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methoxy-thiazol-4-carbonsaure

Zu einer Lösung von 5,4 g (25,2 mmol) 2-Methoxy-thiazol-4-carbonsäure-tert.-butylamid in 150 ml Tetrahydrofuran tropfte man unter Stickstoffatmosphäre bei -70 °C 56 mmol n-Butyllithium (37,3 ml einer 1,5 molaren Lösung in Hexan) und rührte 30 min bei dieser Temperatur. Anschließend goß man das Reaktionsgemisch auf 500 g festes CO₂ und ließ über Nacht stehen. Man engte ein, nahm den Rückstand in 150 ml Wasser und 10 ml 2N NaOH auf, extrahierte zweimal mit je 50 ml Diethylether, säuerte die wäßrige Phase mit konz. Salzsäure auf pH 2 an und extrahierte dreimal mit je 100 ml Ethylacetat. Man trocknete über Magnesiumsulfat und zog das Solvens im Vakuum ab.

Man erhielt 3,9 g (60 %) 5-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methoxy-thiazol-4-carbonsäure als weißes Pulver vom Smp. 105 bis 110° C.

(Wirkstoffbeispiel 2.001)

Beispiel 4

a) 4-Ethoxycarbonyl-2-methyl-oxazol-5-carbonsäurechlorid

Zu 12,2 g (61,3 mmol) 4-Ethoxycarbonyl-2-methyl-oxazol-5-carbonsäure tropfte man bei 0 °C 40 ml Thionylchlorid und 1 ml Dimethylformamid und erhitzte 1 h unter Rückfluß. Man zog das überschüssige Thionylchlorid im Vakuum ab und destillierte den Rückstand im Ölpumpenvakuum.

Man erhielt 10,9 g (82 %) 4-Ethoxycarbonyl-2-methyl-oxazol-5-carbonsäurechlorid als gelbes Öl vom Sdp. 103 bis 105 °C/0,1 Torr. 1 H-NMR (250 MHz, CDCl₃): δ = 1,42 (t; 3H), 2,66 (s; 3H), 4,66 (q; 2H).

b) 4-Ethoxycarbonyl-2-methyl-oxazol-5-carbonsäure-tert.-butylamid

Zu 10,9 g (50,3 mmol) 4-Ethoxycarbonyl-2-methyl-oxazol-5-carbonsäurechlorid in 150 ml Dichlormethan tropfte man bei 0°C eine Lösung von 11,0 g (150 mmol) tert.-Butylamin in 20 ml Dichlormethan und rührte 12 h bei Raumtemperatur. Man nahm das Reaktionsgemisch in 200 ml Wasser auf, trennte die Phasen, wusch die organische Phase einmal mit gesättigter Natriumhydrogencarbonatlösung sowie gesättigter Natriumchloridlösung, trocknete über Magnesiumsulfat und zog das Solvens im Vakuum am Rotationsverdampfer ab.

Man erhielt 11,9 g (93 %) 4-Ethoxycarbonyl-2-methyl-oxazol-5-carbonsäure-tert.-butylamid als weißen Feststoff vom Smp. 152 bis 155° C.

(Wirkstoffbeispiel 4.001).

Beispiel 5

5 5-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methyl-oxazol-4-carbonsäure

Zu 7,4 g (29,1 mmol) 4-Ethoxycarbonyl-2-methyl-oxazol-5-carbonsäure-tert.-butylamid in 150 ml Ethanol und 50 ml THF tropfte man bei 0°C unter N₂ eine Lösung von 1,2 g (30,0 mmol) Natriumhydroxid in 50 ml Wasser. Man rührte 2 h bei 20°C, zog die Solventien am Rotationsverdampfer im Vakuum ab, nahm den Rückstand in 300 ml Wasser auf, stellte auf pH = 9 ein und extrahierte die wäßrige Phase dreimal mit je 100 ml Diethylether. Anschließend säuerte man mit 6N HCl auf pH = 2 an und extrahierte viermal mit je 150 ml Dichlormethan. Die organische Phase wurde über Natriumsulfat getrocknet und das Solvens im Vakuum abgezogen.

Man erhielt 6,1 g (93 %) 5-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methyl-oxazol-4-carbonsäure als weißen Feststoff vom Smp. 186 bis 188 ° C. (Wirkstoffbeispiel 4.002).

40 Beispiel 6

35

50

a) 4-Ethoxycarbonyl-2-methylthio-thiazol-5-carbonsäurechlorid

3,40 g (13,7 mmol) 4-Ethoxycarbonyl-2-methylthio-thiazol-5-carbonsäure wurden in 50 ml Thionylchlorid gelöst und bis zur Beendigung der Gasentwicklung zum Rückfluß erhitzt. Man entfernte überschüssiges Thionylchlorid im Vakuum und behielt 3,55 g (98 %) Säurechlorid als farbloses Öl zurück.

1H-NMR (CDCl₃, 250 MHz, TMS als interner Standard): 1,50 (t, J=7,0 Hz; 3H), 2,75 (s; 3H), 4,60 (q, J=7,0 Hz; 2H).

b) 4-Ethoxycarbonyl-2-methylthio-thiazol-5-carbonsäure-tert.-butylamid

3,50 g (13,2 mmol) 4-Ethoxycarbonyl-2-methylthio-thiazol-5-carbonsäurechlorid wurden in 20 ml Dichlormethan gelöst und bei 0°C zu einer Lösung von 3,20 g (44 mmol) tert.-Butylamin in 50 ml Dichlormethan getropft. Man ließ das Gemisch auf Raumtemperatur erwärmen, rührte 14 Stunden nach und gab dann 100 ml 10 %ige Salzsäure zu. Die organische Phase wurde abgetrennt, mit 50 ml Wasser gewaschen und über Natriumsulfat getrocknet. Man entfernte das Lösungsmittel im Vakuum und behielt

4,00 g (100 %) Produkt als gelben Kristallbrei zurück.

¹H-NMR (CDCl₃, 250 MHz, TMS als interner Standard): 1,45 (t, J=7,0 Hz; 3H), 1,45 (s; 9H), 2,75 (s; 3H), 4,50 (q, J=7,0 Hz; 2H), 9,90 (s, breit; 1H).

(Wirkstoffbeispiel 2.007)

5

Beispiel 7

10 5-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methylthio-thiazol-4-carbonsäure

4,00 g (13,2 mmol) 4-Ethoxycarbonyl-2-methylthio-thiazol-5-carbonsäure-tert.-butylamid wurden in 50 ml Wasser/Ethanol (2:1) gelöst, mit 0,82 g (14,6 mmol) Kaliumhydroxid in 10 ml Wasser versetzt und zwei Stunden zum Rückfluß erhitzt. Anschließend entfernte man das Lösungsmittelgemisch im Vakuum, nahm den Rückstand mit 50 ml Wasser auf und säuerte mit konzentrierter Salzsäure an. Das ausgefallene Produkt wurde abgesaugt und getrocknet.

Ausbeute: 3,40 g (94 %); Schmelzpunkt: 100 °C. (Wirkstoffbeispiel 2.005).

20 Beispiel 8

4-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methoxy-thiazol-5-carbonsäure-acetonoximester

Zu einer Lösung von 3,1 g (12,0 mmol) 4-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methoxy-thiazol-5-carbonsäure und 1,2 g (16,4 mmol) Acetonoxim in 100 ml Dichlormethan tropfte man bei Raumtemperatur 4,4 g (43,6 mmol) 4-Methylmorpholin sowie 1,5 g (12,3 mmol) 4-Dimethylaminopyridin und rührte 5 min. Anschließend fügte man 10,1 g einer 50 %igen Lösung von Propanphosphonsäureanhydrid in Dichlormethan (= 15,9 mmol) zu und erhitzte 7 h unter Rückfluß. Man engte ein, nahm den Rückstand in 100 ml Ethylacetat auf, extrahierte zweimal mit gesättigter Nariumhydrogencarbonatlösung sowie je einmal mit 5 %iger Zitronensäurelösung, gesättigter Natriumcarbonatlösung und gesättigter Natriumchloridlösung. Die organische Phase wurde über Magnesiumsulfat getrocknet und das Solvens im Vakuum abgezogen.

Man erhielt 3,1 g (82 %) 4-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methoxy-thiazol-5-carbonsäure-acetonoximester als weißes Pulver vom Smp. 128 bis 131 °C. (Wirkstoffbeispiel 1.011).

35

25

Beispiel 9

5-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methyl-oxazol-4-carbonsäure-acetonoximester

Zu einer Lösung von 3,80 g (16,8 mmol) 5-tert.-Butylamino-carbonyl-2-methyl-oxazol-4-carbonsäure und 1,23 g (16,8 mmol) Acetonoxim in 40 ml Tetrahydrofuran tropfte man bei Raumtemperatur 3,46 g (16,8 mmol) Dicyclohexylcarbodiimid in 20 ml Tetrahydrofuran. Man rührte 14 h, saugte den ausgefallenen Niederschlag ab, zog das Solvens im Vakuum ab und chromatographierte den Rückstand an Kieselgel (Lösungsmittel: Cyclohexan:Ethylacetat (1:1)). Man erhielt 2,7 g (57 %) 5-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methyloxazol-4-carbonsäure-acetonoximester als weißen Feststoff vom Smp. 107 bis 111 °C. (Wirkstoffbeispiel 4.003).

Die in den folgenden Tabellen aufgeführten Wirkstoffe wurden analog zu den voranstehenden Verbindungen hergestellt.

55

5 ·		pm)]						ЭН),	H),		7,50 (d; 2H), 8,85 (s; 1H),					
		Daten (°C); NMR (& in ppm)]						7,55 (m;	s) 0		50 (d.) (S.)					
10		MR (8						5'/ '	, 7, 90	=	7,50	. 👄				
		aten C); N						1,50 (s; 9H),	1, 2Н)	s; 1+	1,50 (s; 9H), 7,65 (d, 2H),	16,50 (s; 1H)		_	_	
15		phys. Daten [Fp. (°C);	141-144	138-142	120-122	146-148	194-195	20 (s	75 (n	.60	50 (s 65 (d	, 50 (137	101-107	128-131	128-131
		A F	14	13	12	14	19	1,	7,	16	1,	16	13	10	12	12
20		>	0	0	0	0	0	0			0		0	0	0	0
														13) 2	13)2	13) 2
25														-N=C (CH3) 2	-N=C(CH3)2	-N=C (CH3) 2
	8 / 8 / 8 / 8 / 8 / 8 / 8 / 8 / 8 / 8 /	& ?	I	I	I	I	I	Ŧ			I		I	7		
30	======================================		tertButyl	ropyl	utyl	ropyl	tertButyl	utyl			utyl		utyl	utyl	cyclo-Propyl	utyl
	z=(٠tB۱	: 10-P	tertButyl	c lo-P	rt8	tertButyl			tertButyl		tertButyl	tertButyl	c10-P	tertButyl
35	R 1/	*	tei	cy	te.	cy	te	te			te		te	te	S	te
		R3	x	I	I	I	I	I			I		I	r	· =	: I
40											thio					
								thio			henyl		thio	;	>	ר <u>ל</u> ה
45			Methyl	Methyl	Methoxy	Methoxy	Phenvl	Phenylthi	•		4-Cl-Phenylthio		Methvlth	Methyl	Mothoxy	Methoxy
		R.	£	Ŧ	Ĭ	×	<u> </u>	: =	•		4		I	: 3	: ≆	E E
50		Beispiel Nr.	10	02	03	700	005	1.006	}		1.007		800		600.1	010
		Be i	1.001	1.0	-				•		1.6		-	-	-	

Tabelle 1	Tabelle l (Fortsetzung)						-
Beispiel Nr.	R1	R 3	R4	RS	>	phys. Daten [Fp. (°C); NMR (8 in ppm)]	- '
1.012	Methyl	±	cyclo-Propyl	-N=C (CH ₃) ₂	0	0,66 (m; 2H), 0,89 (m; 2H), 2,10 (s, 3H), 2,12 (s; 3H), 2,77 (s; 3H), 2,94 (m; 1H), 8,23 (s; 1H)	
1.013	Phenyl	x	tertButyl	-N=C (CH ₃) ₂	0	143-146	
1.014	n-Butyl-S-	I	tertButyl	I	0	7.1	
1.015	iso-Propyl-S-	I	tertButyl	I	0	97	
1.016	4-F-Benzyl	I	tertButyl	I	0	93	
1.017	2-Phenyl-ethyl	I	tertButyl	I	0	76	
1.018	Methoxy-methyl	×	tertButyl	I	0	100	
1.019	2, 4-C1, C1-Benzyl	#	tertButyl	I	0	100-102	
1.020	3-CF ₃ -Benzyl	=	tertButyl	I	0	109-110	
1.021	Benzyl	I	tertButyl	I	0	128	
1.022	tertButyl	I	tertButyl	I	0	132	
1.023	cvclo-Propvl	I	tertButyl	=	0	142	
1.024	4-C1-Phenoxy-	I	tertButyl	I	0	148-150	
	methyl						
1.025	iso-Propyl	I	tertButyl	I	0	150-153	
1.026	4-Phenoxy-phenyl	Ξ-	tertButyl	I	0	158-161	
1.027	3, 4, 5-Trimeth-	I	tertButyl	I	0	162-164	
	[ntuesquare						

								1;3Н),
5) (q;1H),		5-7,45 (m
10		8 in ppm)]				1,51 (s;9H), 1,78 (d;2H), 4,40 (q;1H), 7,16-7,45 (m;5H), 8,00 (s;1H),		,50 (s;9H), 4,61 (s;2H), 7,25-7,45 (m;3H), ,95 (s;1H), 16-70 (s;1H)
15		phys. Daten [Fp. (°C); NMR (ð in ppm)]				(s;9H), 1,78 7,45 (m;5H),	16-80 (s;1H)	1,50 (s;9H), 4,61 (s;2H), 7,95 (s;1H), 16-70 (s;1H)
20		phys. [Fp.	201	199	147	1,51 (7,16-7	16-80	1, 50 (7, 95 (
25		>	0	0	0	0		0
30		25	I	N.	Ŧ	Ŧ		I
35		**	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl		tertButyl
40		R3	I	I	I	I		Ξ.
45	Tabelle 1 (Fortsetzung)	R1	2-Pyridyl	4-F-Benzyl	×	1-Phenyl-ethyl		2,6-Cl,Cl-Benzyl H
.· .:	Tabelle 1 (Beispiel Nr.	1.028	1.029	1.030	1.031		1.032

10	e	Daten (°C); NMR (ð in ppm)]							1,45 (t,3H); 2,75 (s,3H); 4,5 (q,2H),			1,45 (s,9H); 1,50 (d,6H); 3,80 (~sept.",1H) 10,0 (s,1H)						
20		phys. Daten [Fp. (°C); NMR	105-110	120	136	167	100	15-77	1,45 (t,3H); 2	9, 9 (S, 1H)	10	1,45 (s,9H); 1 10,0 (s,1H)	84	105-106	115	120-121		143
25		>	0	0	0	0	0	0	0	c	>	0	0	0	0	c) (0
30	7 7 7 2 4 5 3 4 4 5 5	25	I	Ŧ	Methyl	x	I	Ŧ	Ethyl	;	I	I	±	I	Ŧ	ı	E	r
35	N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	4	tertButyl	tertButyl	4-C1-Phenyl	4-Cl-Phenyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	•	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	[n+110] - 4444	tertButyl	tertButyl
40		R 3	I	I	I	I	I	I o	I		I	I	Ξ	I	I		Ŧ	I
4 5		R1	Methoxy	Phenyl	Phenyl	Phenyl	Methylthio	4-Cl-Phenylthio	SCH ₃		n-Butyl-S-	iso-Propyl-S-	cvclo-Propyl	iso-Propy1	3,4,5-Trimeth-	oxy-benzyl	Methoxy-methyl	tertButyl
55	Tabelle 2	Beispiel Nr.	2.001	2.002	2.003	2.004	2.005	2.006	2.007		2.008	5.009	2,010	2 011	2.012	:	2.013	2.014

5				0,95-1,08 (m,;2H), 1,15-1,28 (m;2H), 1,45 (t;3H), 1,45 (s;9H), 2,28-2,42 (m;1H),		(s;3H), 4,75 (s;2H),	1H),	3,50 (s;3H),	9,95 (s;1H)	1,45 (s;9H), 4,30 (s;2H), 6,95-7,15 (m;2H),	(H)
10		R (ø in ppm)]		;2H), 1,15-1, 1,45 (s;9H),	9,92 (s;1н)	3,55 (s;3H),	1H), 9,98 (S;	1, 45 (s;9H);	4,75 (s;2H),	4,30 (s;2H),	2H), 9,95 (s)
20		phys. Daten [Fp. (°C); NMR (ð in ppm)]	152-156	0,95-1,08 (m,;2H), 1,15-1,28 (m;2H), 1,45 (t;3H), 1,45 (s;9H), 2,28-2,42	4,45 (q;2H), 9,92 (s;1H)	1,45 (s;9H), 3,55	9, 18-9, 65 (s;1H), 9, 98 (s;1H),	1,42 (t;3H), 1,45 (s;9H); 3,50 (s;3H),	4,50 (q;2H), 4,75 (s;2H), 9,95 (s;1H)	1,45 (s;9H),	7,20-7,35 (m;2H), 9,95 (s;1H)
· 25		>	0	0		0		0		0	
30		R5	Ethy 1	Ethyl		I		Ethyl		I	
35 _.		R4	tertButyl	tertButyl		tertButyl		tertButyl		tertButyl	,
40		R3	I	I		I		I		I	:
45	Tabelle 2 (Fortsetzung)	R1	Benzyl	cyclo-Propyl		Methoxy-methyl		Methoxy-methyl		4-F-Renzv]	
55	Tabelle 2	Beispiel Nr.	2.015	2.016		2.017		2.018)	2 010	610.7

· 5	_																				
10			R (ø in ppm)]																		
15			phys. Daten [Fp. (°C); NMR (ð in ppm)]	152-157	130-131	135-138	169-172	117	151-153	109-112	04-10	107-109	87-90	118-120	121-125	62-65	62-92	101-104	148-151	103-106	126-129
·			>	0	0	0	0	0	0	0	0.	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
25 30	_		RS	I	I	I	I	I	I	I	I	-N=C(CH ₃) ₂	-N=C (CH ₃) ₂	x	-N=C(CH ₃) ₂	=					
35		R1	R4	tertButyl	tertButyl	cyclo-Propyl	3-CF ₃ -Phenyl	tertButyl	tertButyl	cyclo-Propyl	iso-Propyl	tertButyl	cyclo-Propyl	3-CF ₃ -Phenyl	tertButyl	cyclo-Propyl	iso-propyl	_	iso-Propyl	iso-Propyl	cyclo-Propyl
40			83	I	I	I	I	I	I	I	I	I	I	I	I	I	Ξ.	Ŧ	I	I	I
4 5			18	Methyl	Ethyl	Ethyl	Ethyl	cyclo-Propyl	iso-Propyl	iso-Propyl	iso-Propyl	Ethyl	Ethyl	Ethyl	iso-Propyl	iso-Propyl	iso-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl
55	Tabelle 3		Beispiel Nr.	3.001	3.002	3.003	3.004	3.005	3.006	3.007	3.008	3.009	3.010	3.011	3.012	3.013	3.014	3.015	3.016	3.017	3.018

55	50	45	40	35	30	25	20	15	10		5
Tabelle 3	Tabelle 3 (Fortsetzung)	lg)	•	·							
Beispiel	R1	R 3		R4	R5	>	phys. Daten				
N.							[Fp. (°C); NMR (8 in ppm)]	MR (å in	[(mdd		_
3.019	cyclo-Propyl	H lkc	J	cyclo-Propyl	-N=C(CH ₃) ₂	0	108-110				
3.020	cyclo-Propyl	y) H	7	4-Cl-Phenyl	I	0	213-215				
3.021	Ethyl	I		iso-Propyl	I	0	103-106				
3.022	Ethyl	I		iso-Propyl	-N=C(CH3)2	0	93-95				
3.023	Ethyl	I	_	tertButyl	-N=C(cyclo-	0	107-110				
					Propyl) ₂						
3.024	iso-Propyl	=	_	tertButyl	CH 2-C≡CH	0	1,42 (d;6н),	1,44 (s	; 6н);	19'7	1,44 (s;9H), 2,61 (t;1H),
							3,18 (m;1H), E	5,00 (d;2H),	;2H),	9, 46	8, 46 (bs;1H,NH)
3.025	Pheny 1	x	_	tertButyl	I	0	203-206				
3.026	Phenyl	I		iso-Propyl	I	0	144-146				
3.027	Pheny 1	Ξ	_	cyclo-Propyl	I	0	217-218				
3.028	iso-Propyl	=	-	tertButyl	4-CH ₃ 0-Phenyl	0	137-139				
3.029	cyclo-Propyl	y) H	7	4-Cl-Phenyl	-N=C (CH3) 2	0	126-128				
3.030	Pheny 1	Ξ	_	tertButyl	-N=C (CH3) 2	0	149-154				
3.031	Pheny 1	I	•	cyclo-Propyl	-N=C (CH ₃) ₂	0	160-164				
3.032	cyclo-Hexy	Y1 H	-	tertButyl	-N=C (CH ₃) ₂	0	121-125				
3.033	cyclo-Hexy	yl H	•	cyclo-Propyl	I	0	117-119				
3.034	cyclo-Hexy	yl H	•	cyclo-Propyl	-N=C (CH ₃) ₂	0	119-122				
3.035	Phenyl	I		iso-Propyl	-N=C (CH ₃) ₂	0	137-139				
3.036	n-Propyl	Ŧ	•-	tertButyl	I	0	108-110				
3.037	n-Propyl	I		tertButyl	-N=C(CH ₃) ₂	0	69-72				
3.038	n-Propyl	I	-	cyclo-Propyl	 =	0	120-123				
3.039	n-Propyl	x	-	2, 4-(CH ₃) ₂ -	I	0	142-145				
			~	Phenyl							

5	_							·				
10			phys. Daten [Fp. (°C); NMR (0 in ppm)]	104-109	176-178	132-134	114-118		125-128	123-126	124-127	
20			<u>,</u>	0	0	0	0 1		0	0	0 1	
25 30			R5		I	I	I		-N=C(CH ₃) ₂	-N=C (CH ₃) ₂	-N=C (CH ₃) ₂	
35			R4	tertButyl	tertButyl	cyclo-Propyl	-сн-сн ₃	cyclo-Propyl	tertButyl	cyclo-Propyl	-CH-CH ₃	l cyclo-Propyl
40			R 3	I	I	I	I		I	I	±	
45		Tabelle 3 (Fortsetzung)	181	Methoxymethyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl		tertButyl	tertButyl	tertButyl	
50 65		Tabelle 3	Beispiel Nr.	3.040	3.041	3.042	3.043		3.044	3.045	3.046	

5 .	-			pm)]					
10				Daten (°C); NMR (å in ppm)]					
15				phys. Daten [Fp. (°C); N	152-155	186-188	107-111	155-166	230-232.
20				>	0	0	0	0	0
25			78. 48. 48. 48. 48. 48. 48. 48. 48. 48. 4	25	Ethyl	I	-N=C(CH ₃) ₂	Ethyl	I
30		0=	2	7. F.	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl
35					•	_	•		
40				R 3	I	I	I	I	I
4 5				R1	Methyl	Methy1	Methyl	Phenyl	Pheny l
50		Tabelle 4		Beispiel Nr.	4.001	4.002	4.003	4.004	4.005

Anwendungsbeispiele

55

Die herbizide Wirkung der Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide der Formeln la und lb ließ sich durch Gewächshausversuche zeigen:

Als Kulturgefäße dienten Plastikblumentöpfe mit lehmigem Sand mit etwa 3,0 % Humus als Substrat. Die Samen der Testoflanzen wurden nach Arten getrennt eingesät.

Bei Vorauflaufbehandlung wurden die in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffe direkt nach Einsaat mittels fein verteilender Düsen aufgebracht. Die Gefäße wurden leicht beregnet, um Keimung und Wachstum zu fördem und anschließend mit durchsichtigen Plastikhauben abgedeckt, bis die Pflanzen angewachsen waren. Diese Abdeckung bewirkt ein gleichmäßiges Keimen der Testpflanzen, sofern dies nicht durch die Wirkstoffe beeinträchtigt wurde.

Zum Zwecke der Nachauflaufbehandlung wurden die Testpflanzen je nach Wuchsform erst bei einer Wuchshöhe von 3 bis 15 cm mit den in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffen behandelt. Die Aufwandmenge für die Nachauflaufbehandlung betrug 1,0 kg/ha a.S.

Die Pflanzen wurden artenspezifisch bei Temperaturen von 10-25 °C bzw. 20-35 °C gehalten. Die Versuchsperiode erstreckte sich über 2 bis 4 Wochen. Während dieser Zeit wurden die Pflanzen gepflegt und ihre Reaktion auf die einzelnen Behandlungen wurde ausgewertet.

Bewertet wurde nach einer Skala von 0 bis 100. Dabei bedeutet 100 kein Aufgang der Pflanzen bzw. völlige Zerstörung zumindest der oberirdischen Teile und 0 keine Schädigung oder normaler Wachstumsverlauf.

Die in den Gewächshausversuchen verwendeten Pflanzen setzten sich aus folgenden Arten zusammen:

Lateinischer Name	Deutscher Name
Cassia tora	Gumüse-Kassie
Chenopodium album	Weißer Gänsefuß
Chrysanthemum coronarium	Kronenwucherblume
Ipomoea spp.	Prunkwindearten
<u> </u>	1 0

Chrysanthemum coronarium
Ipomoea spp.
Triticum aestivum
Veronica spp.

Kronenwucherblum
Prunkwindearten
Sommerweizen
Ehrenpreisarten

Mit 1,0 kg/ha a.S. im Nachauflaufverfahren eingesetzt, lassen sich mit den Beispielen 1.001, 1.003, 1.004, 1.009, 1.010, 1.011, 3,002, 3,005 und 3,024 breitblättrige unerwünschte Pflanzen sehr gut bekämpfen. Verbindungen 1.001, 1.003 und 1.009 zeigen gleichzeitig Kulturpflanzenverträglichkeit an Weizen. Verbindung 3.005 wird sehr gut von der Kulturpflanze Mais toleriert.

Ansprüche

20

25

30

35

45

1. Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide der Formeln la und lb

in denen die Substituenten folgende Bedeutung haben:

X Sauerstoff oder Schwefel;

R¹ Wasserstoff; Halogen; C₁-C₅-Alkyl, welches ein bis fünf Halogenatome und/oder einen oder zwei der folgenden Reste tragen kann: C₃-C₅-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio oder Cyano;

Benzyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro;

C₃-C₈-Cycloalkyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: C₁-C₄-Alkyl oder Halogen; C₂-C₆-Alkenyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen, C₁-C₃-Alkoxy und/oder ein Phenyl, das seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro;

- C₂-C₆-Alkinyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen oder C₁-C₃-Alkoxy und/oder ein Phenyl, das seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro;
- 5 C₁-C₄-Alkoxy; C₁-C₄-Alkylthio; C₁-C₄-Halogenalkoxy; C₁-C₄-Halogenalkylthio; Phenoxy oder Phenylthio, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro;
- ein 5- bis 6-gliedriger heterocyclischer Rest, enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der 10 Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, wobei der Ring ein oder zwei der folgenden Reste tragen kann: C₁-C₃-Alkyl, Halogen, C₁-C₃-Alkoxy oder C₁-C₃-Alkoxycarbonyl;
 - Phenyl, welches eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, Halogen, Nitro und Cyano, R² Formyl, 4,5-Dihydrooxazol-2-yl oder den Rest -COYR⁵;
- 15 Y Sauerstoff oder Schwefel;
 - R5 Wasserstoff;
 - C₁-C₅-Alkyl, welches ein bis fünf Halogenatome oder Hydroxygruppen und/oder einen der folgenden Reste tragen kann: C₁-C₄-Alkoxy, C₂-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy, Cyano, Trimethylsilyl, C₁-C₃-Alkylthio, C₁
- 20 C₃-Alkoxycarbonyl, C₁-C₃-Dialkylaminocarbonyl, C₁-C₃-Dialkoxyphosphonyl, Alkaniminoxy, Thienyl, Furyl, Tetrahydrofuryl, Phthalimido, Pyridyl, Benzyloxy, Benzoyl, wobei die cyclischen Reste ihrerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy oder Halogen;
 - Benzyl, das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy, C₁-C₃-Halogenal-kyl, Halogen, Nitro und Cyano;
- 25 C₃-C₈-Cycloalkyl;
 - Phenyl, das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenal-kyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, Halogen, Nitro und Cyano;
 - C₃-C₈-Alkenyl, C₅-C₆-Cycloalkenyl oder C₃-C₈-Alkinyl, wobei diese Reste eine der folgenden Gruppen tragen können: Hydroxy, C₁-C₄-Alkoxy, Halogen oder einen Phenylring, welcher seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, Halogen, Nitro und Cyano;
 - einen fünf- bis sechsgliedrigen heterocyclischen Rest enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff oder einen Benzotriazolrest;
 - Phthalimido; Tetrahydrophthalimido; Succinimido; Maleinimido;
- ein Äquivalent eines Kations aus der Gruppe der Alkali- oder Erdalkalimetalle, Mangan, Kupfer, Eisen, Ammonium und substituiertes Ammonium; einen Rest -N = CR⁶ R⁷;
 - R^5 , R^7 Wasserstoff; C_1 - C_4 -Alkyl; C_3 - C_6 -Cycloalkyl; Phenyl oder Furyl oder zusammen eine Methylenkette der Formel - $(CH_2)_m$ mit m = 4 bis 7 Kettengliedern;
- 40 R³ Wasserstoff; C₁-C₅-Alkyl, das einen bis drei der folgenden Substituenten tragen kann: Hydroxy, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio oder Di-C₁-C₃-Alkylamino;
 - C₃-C₈-Cycloalkyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: C₁-C₄-Alkyl, Halogen und C₁-C₄-Halogenalkyl;
 - R⁴ Hydroxy; C₁-C₄-Alkoxy;
- C₁-C₅-Alkyl, das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Dialkylamino, Halogen, C₃-C₈-Cycloalkyl oder Phenyl, welches seinerseits ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkylthio;
 - C₃-C₈-Cycloalkyl, das eine bis drei der folgenden Grupen tragen kann: C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Halogen, Nitro oder Cyano;
 - C₃-C₆-Alkenyl oder C₃-C₆-Alkinyl, das ein- bis dreimal durch Halogen und/oder einmal durch Phenyl substituiert sein kann, wobei der Phenylring seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro;
- ein 5- bis 6-gliedriger heterocyclischer Rest enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel oder Stickstoff, welcher ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: C1-C4-Alkvl oder Halogen:
 - Phenyl, das eine bis vier der folgenden Gruppen tragen kann: C1-C4-Alkyl, C1-C4-Halogenalkyl, C1-C4-

Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Halogen, Nitro, Cyano, Formyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl;

Naphthyl, das ein- bis dreimal durch C₁-C₄-Alkyl oder Halogen substituiert sein kann, oder

R³ und R⁴ gemeinsam einen Rest der Struktur -(CH₂)_n-Y_p-(CH₂)_q-, wobei n und q 1, 2 oder 3, p 0 oder 1 und Y Sauerstoff, Schwefel oder N-Methyl bedeuten oder den Rest der Formel -(CH₂)₃-CO-bilden, sowie deren umweltverträgliche Salze,

wobei in der Formel Ib X nicht Schwefel bedeutet, wenn R¹ 3-Pyridyl, R² CO₂CH₂CH₃ oder R³ Wasserstoff bedeutet, und wobei in der Formel Ia X nicht Schwefel oder R¹ nicht Thien-2-yl bedeutet, wenn YR⁵ für OH steht und R³ Wasserstoff und R⁴ Methyl bedeutet.

- 2. Oxazol- oder Thiazolcarbonsäureamide der Formeln la und lb nach Anspruch 1, in denen R³ Wasserstoff bedeutet.
- 3. Oxazol- oder Thiazolcarbonsäureamide der Formeln la und Ib nach Anspruch 1, in denen die Substituenten folgende Bedeutung haben:
- R¹ Wasserstoff; C₁-C₄-Alkyl; C₁-C₄-Alkoxy; C₁-C₄-Halogenalkoxy; C₁-C₄-Alkylthio oder C₁-C₄-Halogenalkylthio:

R² einen Rest -COYR⁵:

R⁵ Wasserstoff; Phthalimido; Succinimido; Maleinimido oder ein Rest -N = R⁶ R⁷

 R^6 , R^7 Wasserstoff; C_1 - C_4 -Alkyl und C_3 - C_6 -Cycloalkyl oder zusammen eine Methylenkette der Formel -- $(CH_2)_m$ - mit m=4 bis 7 Kettengliedern,

R3 Wasserstoff und

25

30

35

40

50

R⁴ C₁-C₄-Alkyl oder C₃-C₈-Cycloalkyl.

4. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und Ib gemäß Anspruch 1, in denen R^2 CO_2R^5 und R^5 C_1 - C_6 -Alkyl bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man einen Diester der Formel II

N OR5
OR5
OR5

II

in an sich bekannter Weise mit einem Äquivalent einer wäßrigen Base zu einem Gemisch der Monoester Illa und Illb

R1 X OH

R1 X OH

IIIa IIIb

hydrolysiert und IIIa und IIIb danach getrennt oder im Gemisch zunächst in das Halogenid oder eine andere aktivierte Form der Carbonsäure überführt und diese Derivate anschließend mit einem Amin der Formel IV

amidiert

5. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und Ib gemäß Anspruch 1, in denen X Schwefel und R² CO₂H bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Dicarbonsäureanhydrid der Formel V

in an sich bekannter Weise mit einem Amin der Formei IV gemäß Anspruch 4 zu den Isomeren la und Ib umsetzt und anschließend das Gemisch in die Isomeren auftrennt.

6. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und Ib gemäß Anspruch 1, in denen R¹ nicht Halogen und R² Carboxyl oder Formyl bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man eine Carbonsäure der Formel Illc bzw. Illd

in an sich bekannter Weise zunächst gemäß Anspruch 4 aktiviert und amidiert und das so erhaltene Amid VIa bzw. VIb

anschließend in Gegenwart einer Base mit einem Carboxylierungs- oder einem Formylierungsreagens umsetzt.

7. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und lb gemäß Anspruch 1, in denen R² CO₂H bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Carbonsäureamid la bzw. lb in dem R² CO₂R⁵ und R⁵ C₁-C₅-Alkyl bedeutet in an sich bekannter Weise mit einem Äquivalent einer wäßrigen Base hydrolysiert.

8. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen Ia und Ib, in denen R^2 COYR⁵ bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man eine entsprechende Carbonsäure Ia bzw. Ib (R^2 = CO_2H) gemäß Anspruch 4 aktiviert und anschließend in an sich bekannter Weise mit einer Verbindung VII HYR⁵ VII

umsetzt.

5

15

25

30

45

9. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und lb, in denen R^2 4,5-Dihydrooxazol-2-yl bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man eine entsprechende Carbonsäure la bzw. lb ($R^2 = CO_2H$, CO_2R' ; $R' = C_1-C_4-Alkyl$) in an sich bekannter Weise mit 2-Aminoethanol VIII

umsetzt.

10. Herbizides Mittel, enthaltend neben inerten Zusatzstoffen mindestens ein Oxazol- bzw. Thiazolcarbon-50 säureamid der Formel la bzw. Ib

in der die Substituenten die in Anspruch 1 gegebene Bedeutung haben, und X Schwefel bedeuten kann, wenn R¹ 3-Pyridyl, R² CO₂CH₂CH₃ und R³ Wasserstoff bedeutet, oder wenn R¹ Thien-2-yl, YR⁵ Hydroxy, R³ Wasserstoff und R⁴ Methyl bedeutet.

- 11. Herbizides Mittel nach Anspruch 10, enthaltend neben mindestens einem Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamid der Formel la bzw. Ib und inerten Zusatzstoffen weitere wirksame Bestandteile.
- 12. Verfahren zur Bekämpfung unerwünschten Pflanzenwuchses, dadurch gekennzeichnet, daß man die unerwünschten Pflanzen und/oder die von unerwünschten Pflanzenwuchs freizuhaltende Fläche mit einer herbizid wirksamen Menge eines Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamids der Formel la bzw. lb behandelt.